

Rec'd PCT/PTO 28 NOV 2006

10/555894

Best Available Copy

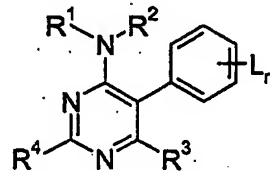
PRIORITY DOCUMENT.

FOR :- EPO4/04957.

10/555894

## Patentansprüche

## 1. 2-Substituierte Pyrimidine der Formel I



in der der Index und die Substituenten die folgende Bedeutung haben:

n eine ganze Zahl von 1 bis 5, wobei mindestens ein Substituent L in ortho-Stellung am Phenylring sitzt

L Halogen, Cyano, Cyanato (OCN), C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>-Alkynyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, -C(=O)-A, -C(=O)-O-A, -C(=O)-N(A')A, C(A') (=N-OA), N(A')A, N(A')-C(=O)-A, N(A'')-C(=O)-N(A')A, S(=O)<sub>m</sub>-A, S(=O)<sub>m</sub>-O-A oder S(=O)<sub>m</sub>-N(A')A,

m 0, 1 oder 2;

A, A', A'' unabhängig voneinander Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkynyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkenyl, Phenyl, wobei die organischen Reste partiell oder vollständig halogeniert sein können oder durch Cyano oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy substituiert sein können; oder A und A' zusammen mit den Atomen an die sie gebunden sind für einen fünf- bis sechsgliedrigen gesättigten, partiell ungesättigten oder aromatischen Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S, stehen;

wobei die aliphatischen, alicyclischen oder aromatischen Gruppen der Restdefinitionen von L ihrerseits partiell oder vollständig halogeniert sein oder eine bis vier Gruppen R<sup>u</sup> tragen können:

R<sup>u</sup> Halogen, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>-Alkynyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>-Alkenyloxy, C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>-Alkynyloxy, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkenyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkoxy, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkenyloxy, -C(=O)-A, -C(=O)-O-A, -C(=O)-N(A')A, C(A') (=N-OA), N(A')A, N(A')-C(=O)-A, N(A'')-C(=O)-N(A')A, S(=O)<sub>m</sub>-A, S(=O)<sub>m</sub>-O-A oder S(=O)<sub>m</sub>-N(A')A, wobei m, A, A', A'' die vorgenannte Bedeutung haben und wobei die aliphatischen, alicyclischen oder aromatischen Gruppen ihrerseits partiell oder voll-

ständig halogeniert sein oder eine bis drei Gruppen  $R^v$  tragen können, wobei  $R^v$  die gleiche Bedeutung wie  $R^u$  besitzt;

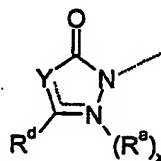
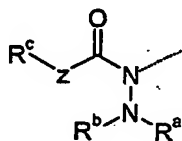
$R^1, R^2$  unabhängig voneinander  $C_1-C_6$ -Alkyl,  $C_3-C_6$ -Cycloalkyl,  $C_2-C_6$ -Alkenyl,  $C_2-C_6$ -Alkynyl,  $C_1-C_6$ -Halogenalkyl,  $C_3-C_6$ -Halogenocycloalkyl,  $C_2-C_6$ -Halogenalkenyl oder  $C_2-C_6$ -Halogenalkynyl;

$R^2$  kann zusätzlich Wasserstoff bedeuten;

$R^1$  und  $R^2$  können auch zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen gesättigten oder ungesättigten fünf- oder sechsgliedrigen Ring bilden, der durch eine Ether- $(-O-)$ , Carbonyl- $(C=O)$ -, Thio- $(-S-)$ , Sulfoxyl- $(-S(=O)-)$  oder Sulfenyl- $(-SO_2-)$  Gruppe unterbrochen sein kann;

$R^3$  Halogen, Cyano,  $C_1-C_4$ -Alkyl,  $C_2-C_4$ -Alkenyl,  $C_2-C_4$ -Alkynyl,  $C_1-C_4$ -Alkoxy,  $C_3-C_4$ -Alkenyloxy oder  $C_3-C_4$ -Alkynyloxy, wobei die Alkyl, Alkenyl und Alkynylreste von  $R^3$  durch Halogen, Cyano, Nitro,  $C_1-C_2$ -Alkoxy oder  $C_1-C_4$ -Alkoxycarbonyl substituiert sein können.

$R^4$  einer der Formeln



entspricht, wobei

$x$  0 oder 1 bedeutet;

$R^a, R^b$  und  $R^c, R^d$  unabhängig voneinander Wasserstoff,  $C_1-C_6$ -Alkyl,  $C_2-C_6$ -Alkenyl,  $C_2-C_6$ -Alkynyl,  $C_3-C_6$ -Cycloalkyl,  $C_4-C_6$ -Cycloalkenyl,

$R^a, R^b$  zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, die Bedeutung  $R^c-Z-C(R^d)=N$  haben können;

$Z$  Sauerstoff oder  $N-R^c$  bedeutet;

$Y$   $C(H)-R^e, C-R^e, N-N(H)-R^e$  oder  $N-R^e$  bedeutet;

$\text{---}$  eine Doppel oder Einfachbindung bedeuten kann;

3

$R^d$ ,  $R^e$  die gleiche Bedeutungen wie  $R^c$  haben und zusätzlich Halogen oder Cyano bedeuten können;

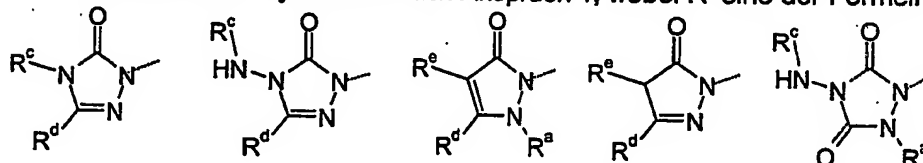
$R^d$  zusammen mit dem Kohlenstoff an das es gebunden ist, eine Carbonylgruppe bedeuten kann;

wobei die aliphatischen, alicyclischen oder aromatischen Gruppen der Restdefinitionen von  $R^a$ ,  $R^b$ ,  $R^c$ ,  $R^d$  oder  $R^e$  ihrerseits partiell oder vollständig halogeniert sein oder eine bis vier Gruppen  $R^w$  tragen können:

$R^w$  Halogen, Cyano,  $C_1$ - $C_8$ -Alkyl,  $C_2$ - $C_{10}$ -Alkenyl,  $C_2$ - $C_{10}$ -Alkynyl,  $C_1$ - $C_6$ -Alkoxy,  $C_2$ - $C_{10}$ -Alkenyloxy,  $C_2$ - $C_{10}$ -Alkynyloxy,  $C_3$ - $C_6$ -Cycloalkyl,  $C_3$ - $C_6$ -Cycloalkenyl,  $C_3$ - $C_6$ -Cycloalkoxy,  $C_3$ - $C_6$ -Cycloalkenyloxy, und wobei zwei der Reste  $R^a$ ,  $R^b$ ,  $R^c$  oder  $R^d$  zusammen mit den Atomen an die sie gebunden sind einen fünf- bis sechsgliedrigen gesättigten, partiell ungesättigten oder aromatischen Heterocyclus enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S, bilden können.

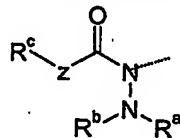
2. 2-Substituierte Pyrimidine nach Anspruch 1, wobei  $R^3$  Chlor, Cyano, Methyl, Ethyl oder Brom bedeutet.

3. 2-Substituierte Pyrimidine nach Anspruch 1, wobei  $R^4$  eine der Formeln



bedeutet.

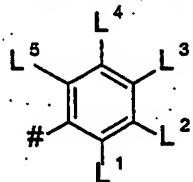
4. 2-Substituierte Pyrimidine nach Anspruch 1, wobei  $R^4$  der Formel



entspricht.

4

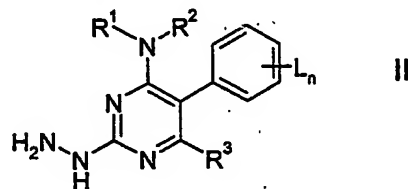
5. 2-Substituierte Pyrimidine nach einem der Ansprüche 1 bis 6, in der die durch  $L_n$  substituierte Phenylgruppe für die Gruppe B



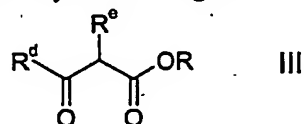
steht, worin # die Verknüpfungsstelle mit dem Pyrimidin-Gerüst ist und

- $L^1$  Fluor, Chlor,  $CH_3$  oder  $CF_3$ ;  
 $L^2, L^4$  unabhängig voneinander Wasserstoff,  $CH_3$  oder Fluor;  
 $L^3$  Wasserstoff, Fluor, Chlor, Cyano,  $CH_3$ ,  $SCH_3$ ,  $OCH_3$ ,  $SO_2CH_3$ ,  $NH-C(=O)CH_3$ ,  $N(CH_3)-C(=O)CH_3$  oder  $COOCH_3$  und  
 $L^5$  Wasserstoff, Fluor, Chlor oder  $CH_3$  bedeuten.

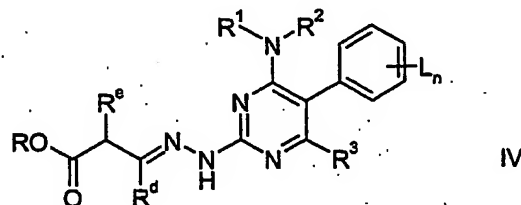
Verfahren zur Herstellung von 2-substituierten Pyrimidinen der Formel I gemäß Anspruch 3, wobei  $R^4$  für ein Pyrazolon steht, dadurch gekennzeichnet, dass man eine Verbindung der Formel II,



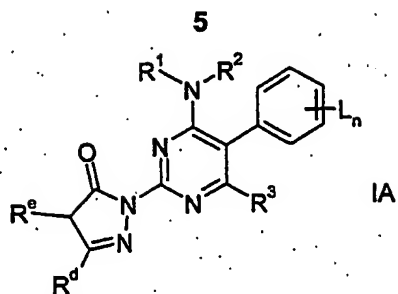
in der die Substituenten  $L$ ,  $R^1$ ,  $R^2$  und  $R^3$  die in Anspruch 1 genannte Bedeutung haben mit einer 1,3-Dicarbonylverbindung der Formel III



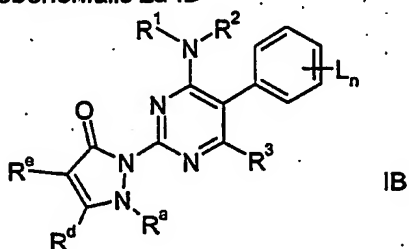
in der  $R^d$  und  $R^e$  die in Anspruch 1 angegebene Bedeutung haben und  $R$  für einen  $C_1$ - $C_6$ -Alkylrest steht, kondensiert und anschließend die erhaltene Verbindung IV



mit einer Base zu IA

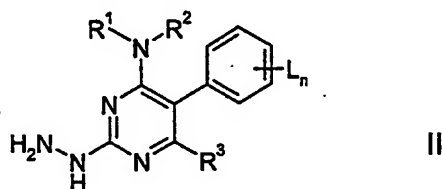


ringschließt und gegebenenfalls zu IB

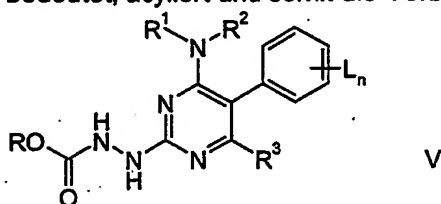


isomerisiert.

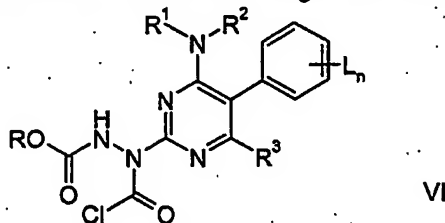
7. Verfahren zur Herstellung von 2-substituierten Pyrimidinen der Formel I gemäß Anspruch 3, wobei R<sup>4</sup> für ein Triazoldion steht, dadurch gekennzeichnet, dass man eine Verbindung der Formel II,



in der die Substituenten L, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> und R<sup>3</sup> die in Anspruch 1 genannte Bedeutung haben mit einem Chlorameisensäureester der Formel ClCO<sub>2</sub>R, wobei der Substituent R C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl bedeutet, acyliert und somit die Verbindung V erhält;

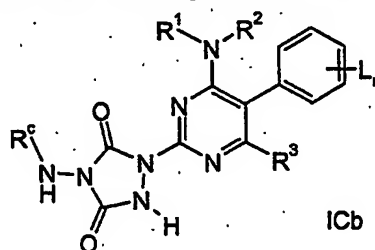
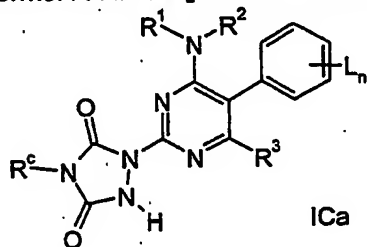


Verbindung V anschließend mit einem Phosgenderivat zu VI umsetzt,



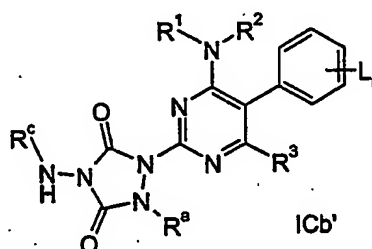
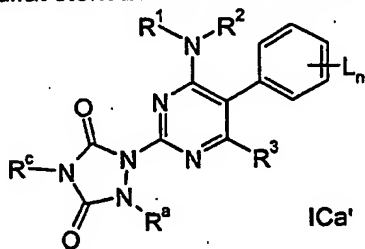
6

VI weiterhin mit einem Amin der Formel  $R^cNH_2$  bzw. mit einem Hydrazin der Formel  $R^cNH-NH_2$  zu den Verbindungen ICa bzw. ICb ringschließt und



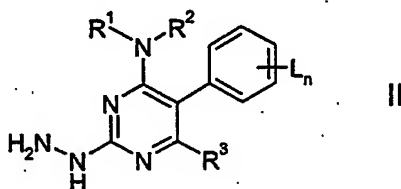
5

gegebenenfalls mit einem Alkylierungsmittel der Formel  $R^aX$ , wobei  $R^a$  die zuvor genannte Bedeutung besitzt und X für eine Abgangsgruppe wie Halogenid oder Sulfat steht zu ICa' bzw. zu ICb'

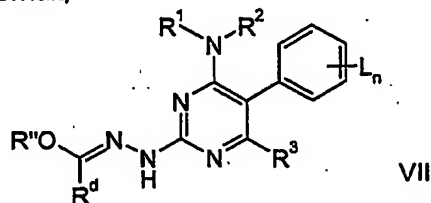


weiter umgesetzt.

- 10 8. Verfahren zur Herstellung von 2-substituierten Pyrimidinen der Formel I gemäß Anspruch 3, wobei  $R^4$  für ein Triazoldion steht, dadurch gekennzeichnet, dass man eine Verbindung der Formel II,

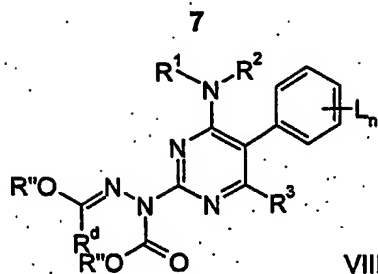


in der die Substituenten L,  $R^1$ ,  $R^2$  und  $R^3$  die in Anspruch 1 genannte Bedeutung haben mit einem Orthoester der Formel  $R^dC(OR'')_3$ , wobei der Substituent  $R^d$  die vorgenannte Bedeutung und  $R''$   $C_1$ - $C_6$ -Alkyl bedeuten, kondensiert und somit die Verbindung VII erhält;

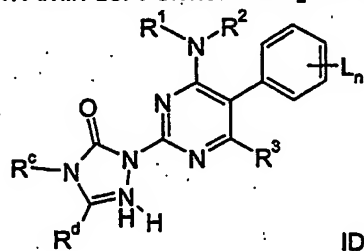


20

Verbindung VII anschließend mit einem Chlorameisensäureester der Formel  $ClCO_2R''$ , wobei der Substituent  $R''$   $C_1$ - $C_6$ -Alkyl bedeutet, zu Verbindung VIII acyliert,

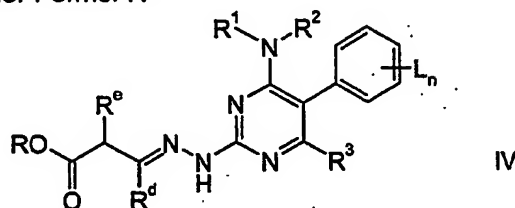


VIII weiterhin mit einem Amin der Formel  $R^cNH_2$  zur Verbindungen ID



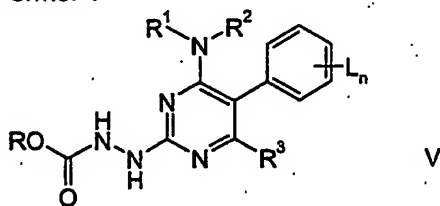
5 ringschließt.

9. Verbindungen der Formel IV



10 wobei die Substituenten  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $L_n$ ,  $R^e$  und  $R^d$  die in Anspruch 1 angegeben Bedeutung haben und der Substituent R für einen  $C_1$ - $C_6$ -Alkylrest steht.

10. Verbindungen der Formel V



15 wobei die Substituenten  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$  und  $L_n$  die in Anspruch 1 angegeben Bedeutung haben und der Substituent R für einen  $C_1$ - $C_6$ -Alkylrest steht.

11. Zur Bekämpfung von Schadpilzen geeignetes Mittel, enthaltend einen festen oder flüssigen Trägerstoff und eine Verbindung der Formel I gemäß Anspruch 1.

20 12. Verfahren zur Bekämpfung von pflanzenpathogenen Schadpilzen, dadurch gekennzeichnet, dass man die Pilze oder die vor Pilzbefall zu schützenden Materialien, Pflanzen, den Boden oder Saatgüter mit einer wirksamen Menge einer Verbindung der Formel I gemäß Anspruch 1 behandelt.



## 2-Substituierte Pyrimidine

## Beschreibung

5 Die Erfindung betrifft 2-substituierte Pyrimidine der Formel I,



in der der Index und die Substituenten die folgende Bedeutung haben:

10 n eine ganze Zahl von 1 bis 5, wobei mindestens ein Substituent L in ortho-Stellung am Phenylring sitzt

15 L Halogen, Cyano, Cyanato (OCN), C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>-Alkynyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, -C(=O)-A, -C(=O)-O-A, -C(=O)-N(A')A, C(A')=(N-OA), N(A')A, N(A')-C(=O)-A, N(A'')-C(=O)-N(A')A, S(=O)<sub>m</sub>-A, S(=O)<sub>m</sub>-O-A oder S(=O)<sub>m</sub>-N(A')A,

20 m 0, 1 oder 2;

25 A, A', A'' unabhängig voneinander Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkynyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkenyl, Phenyl, wobei die organischen Reste partiell oder vollständig halogeniert sein können oder durch Cyano oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy substituiert sein können; oder A und A' zusammen mit den Atomen an die sie gebunden sind für einen fünf- bis sechsgliedrigen gesättigten, partiell ungesättigten oder aromatischen Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S, stehen;

30 wobei die aliphatischen, alicyclischen oder aromatischen Gruppen der Restdefinitionen von L ihrerseits partiell oder vollständig halogeniert sein oder eine bis vier Gruppen R<sup>u</sup> tragen können:

35 R<sup>u</sup> Halogen, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>-Alkynyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>-Alkenyloxy, C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>-Alkynyloxy, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkenyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkoxy, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkenyloxy, -C(=O)-A, -C(=O)-O-A, -C(=O)-N(A')A, C(A')=(N-OA), N(A')A, N(A')-C(=O)-A, N(A'')-C(=O)-N(A')A, S(=O)<sub>m</sub>-A, S(=O)<sub>m</sub>-O-A oder S(=O)<sub>m</sub>-N(A')A, wobei m, A, A', A'' die vorgenannte Bedeutung haben und wobei die aliphatischen, alicyclischen oder aromatischen Gruppen ihrerseits partiell oder vollständig halogeniert sein oder eine bis drei Gruppen R<sup>v</sup> tragen können, wobei R<sup>v</sup> die gleiche Bedeutung wie R<sup>u</sup> besitzt;

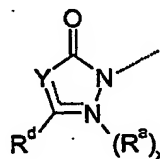
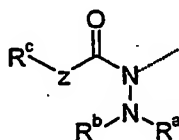
$R^1, R^2$  unabhängig voneinander  $C_1$ - $C_6$ -Alkyl,  $C_3$ - $C_6$ -Cycloalkyl,  $C_2$ - $C_6$ -Alkenyl,  $C_2$ - $C_6$ -Alkynyl,  $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkyl,  $C_3$ - $C_6$ -Halogencycloalkyl,  $C_2$ - $C_6$ -Halogenalkenyl oder  $C_2$ - $C_6$ -Halogenalkynyl;

$R^2$  kann zusätzlich Wasserstoff bedeuten;

$R^1$  und  $R^2$  können auch zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen gesättigten oder ungesättigten fünf- oder sechsgliedrigen Ring bilden, der durch eine Ether-(-O-), Carbonyl -(C=O)-, Thio-(-S-), Sulfoxy-(-S(=O)-) oder Sulfenyl-(-SO<sub>2</sub>-) Gruppe unterbrochen sein kann;

$R^3$  Halogen, Cyano,  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl,  $C_2$ - $C_4$ -Alkenyl,  $C_2$ - $C_4$ -Alkynyl,  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxy,  $C_3$ - $C_4$ -Alkenyloxy oder  $C_3$ - $C_4$ -Alkynyloxy, wobei die Alkyl, Alkenyl und Alkynyreste von  $R^3$  durch Halogen, Cyano, Nitro,  $C_1$ - $C_2$ -Alkoxy oder  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxy-carbonyl substituiert sein können.

$R^4$  einer der Formeln



entspricht, wobei

$x$  0 oder 1 bedeutet;

$R^a, R^b$  und  $R^c, R^d$  unabhängig voneinander Wasserstoff,  $C_1$ - $C_6$ -Alkyl,  $C_2$ - $C_6$ -Alkenyl,  $C_2$ - $C_6$ -Alkynyl,  $C_3$ - $C_6$ -Cycloalkyl,  $C_4$ - $C_6$ -Cycloalkenyl,

$R^a, R^b$  zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, die Bedeutung  $R^c$ -Z-C( $R^d$ )=N haben können;

Z Sauerstoff oder N- $R^c$  bedeutet;

Y C(H)- $R^e$ , C- $R^e$ , N-N(H)- $R^c$  oder N- $R^c$  bedeutet;

--- eine Doppel oder Einfachbindung bedeuten kann;

## 3

$R^d$ ,  $R^e$  die gleiche Bedeutungen wie  $R^c$  haben und zusätzlich Halogen oder Cyano bedeuten können;

$R^d$  zusammen mit dem Kohlenstoff an das es gebunden ist, eine Carbo-  
nylgruppe bedeuten kann;

wobei die aliphatischen, alicyclischen oder aromatischen Gruppen der Restedefinitionen von  $R^a$ ,  $R^b$ ,  $R^c$ ,  $R^d$  oder  $R^e$  ihrerseits partiell oder vollständig halogeniert sein oder eine bis vier Gruppen  $R^w$  tragen können:

$R^w$  Halogen, Cyano,  $C_1$ - $C_8$ -Alkyl,  $C_2$ - $C_{10}$ -Alkenyl,  $C_2$ - $C_{10}$ -Alkynyl,  $C_1$ - $C_6$ -Alkoxy,  $C_2$ - $C_{10}$ -Alkenyloxy,  $C_2$ - $C_{10}$ -Alkynyloxy,  $C_3$ - $C_6$ -Cycloalkyl,  $C_3$ - $C_6$ -Cycloalkenyl,  $C_3$ - $C_6$ -Cycloalkoxy,  $C_3$ - $C_6$ -Cycloalkenyloxy, und wobei zwei der Reste  $R^a$ ,  $R^b$ ,  $R^c$  oder  $R^d$  zusammen mit den Atomen an die sie gebunden sind einen fünf- bis sechsgliedrigen gesättigten, partiell ungesättigten oder aromatischen Heterocyclus enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S, bilden können.

Außerdem betrifft die Erfindung ein Verfahren zur Herstellung dieser Verbindungen, sie enthaltende Mittel sowie deren Verwendung zur Bekämpfung pflanzenpathogener Schadpilze.

Aus WO-A 01/96314 sind fungizide Pyrimidine, die in 2-Stellung einen Cyanamino-substituenten tragen, bekannt. Weiterhin sind aus WO 02/74753 fungizide Pyrimidine bekannt, die in 2-Stellung allgemein einen Heterocyclylrest tragen. Spezifisch offenbart sind allerdings nur Heteroaryl substituierte Pyrimidine.

Die Wirkung der o.g. Pyrimidine ist jedoch in vielen Fällen nicht zufriedenstellend. Daher lag als Aufgabe zugrunde, Verbindungen mit verbesserter Wirksamkeit zu finden.

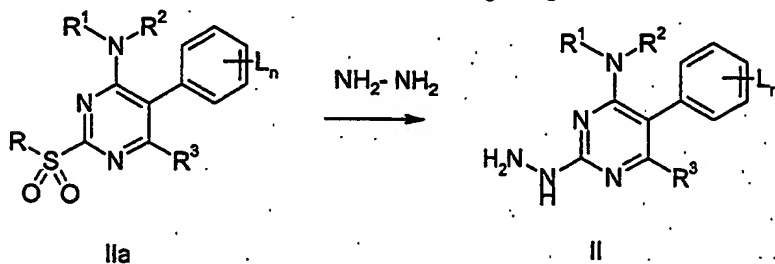
Demgemäß wurden die eingangs definierten Pyrimidine der Formel I gefunden. Außerdem wurden Verfahren zu ihrer Herstellung sowie sie enthaltende Mittel zur Bekämpfung von Schadpilzen gefunden.

Die Verbindungen I können auf verschiedenen Wegen erhalten werden.

- 1) Beispielsweise kann von den Hydrazinopyrimidinen der Formel II ausgegangen werden, deren Herstellung in WO-A 02/074753 oder DE 10156279.9 detailliert be-

4

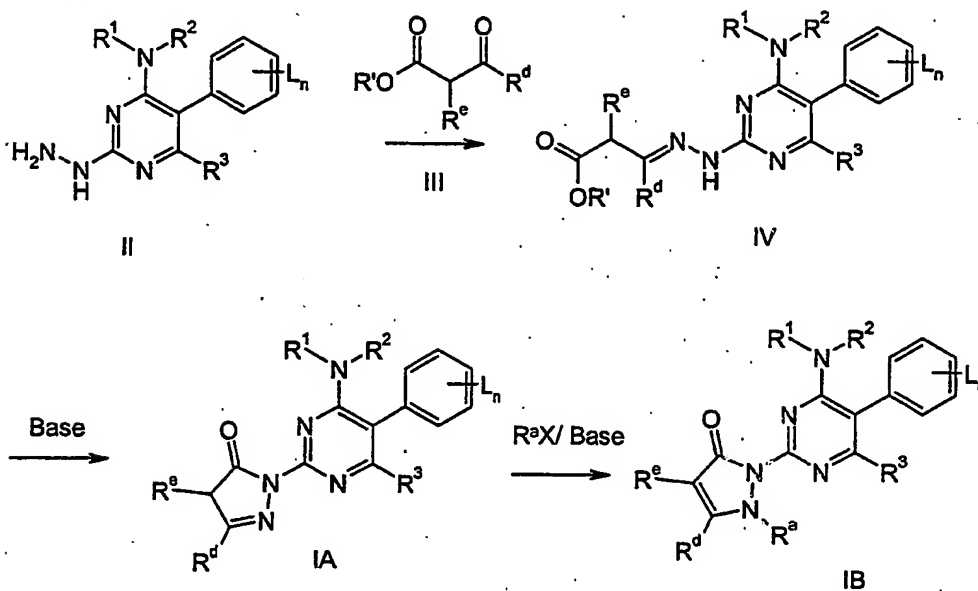
schrieben ist. Im folgenden ist eine bevorzugte Herstellung der Verbindungen II ausgehend von den Sulfonen IIa aufgezeigt.



Die weitere Synthese kann wie in Schema 1 dargestellt erfolgen:

5

Schema 1:



10

15

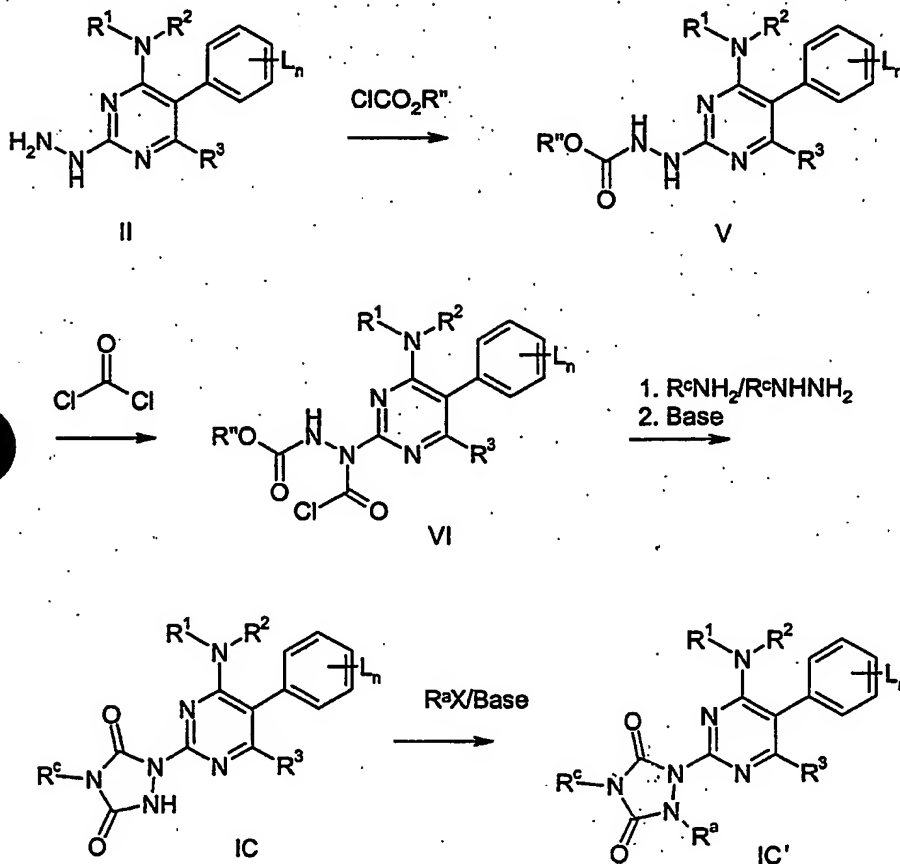
20

Die Hydrazinverbindung II wird mit einer Dicarboxylverbindung III, wobei die Substituenten  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $L_n$ ,  $R^d$  und  $R^e$  die zuvor gegebene Bedeutung haben und  $R'$  eine Alkyl, Aryl oder Benzylgruppe bedeutet, kondensiert (s. Schema 1) und damit die Verbindungen der Formel VI erhalten. Die Dicarboxylverbindungen der Formel III sind aus *Angew. Chem. Int. Ed. Engl.* 1989 28, S. 500 bekannt. Die Kondensation erfolgt wie unter DE 19627002 im näheren ausgeführt. Der Ringschluss zu den erfindungsgemäßen Verbindungen IA erfolgt beispielsweise in Gegenwart von Basen wie insbesondere Alkalimetallalkoxydate. Explizit beschrieben wird die Umsetzung mit Natriummethylat (*Synlett* 1996, 667-8). In Gegenwart von Alkylierungsmittel  $R^aX$ , wobei  $R^a$ , die o.g. Bedeutung und X für eine Abgangsgruppe wie Halogenid, oder Sulfat steht und einer starken Base wie beispielsweise Natriumhydrid oder wasserfreiem Kaliumcarbonat werden die erfindungsgemäßen Verbindungen IB erhalten.

5

2) Das in Schema 2 aufgezeigte Herstellverfahren führt zu den erfindungsgemäßen Verbindungen IC.

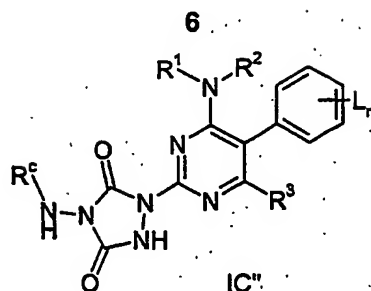
Schema 2:



5

Ausgangspunkt für die Synthese der Verbindungen IC und IC' ist vorzugsweise die Hydrazinverbindung II, deren Herstellung bereits weiter oben eingehend beschrieben wird. Die Umsetzung mit Chlorameisensäureester ( $\text{R}''$  steht für einen Alkylrest) zu den acylierten Verbindungen V erfolgt im allgemeinen in Gegenwart einer Base. Die weitere Umsetzung von V mit Phosgen bzw. einem Phosgenäquivalent zu VI und der anschließende Ringschluss in Gegenwart eines Amins/Hydrazins und einer Base kann analog der in *Chem. Ber.* 1898, 31, Seite 2320 ff beschriebenen Methode erfolgen. Der Ringschluss in Gegenwart von Aminen  $\text{R}^c\text{NH}_2$  führt zu Triazolidindionen IC während der Ringschluss in Gegenwart von Hydrazinen  $\text{R}^c\text{NH-NH}_2$  zu den Verbindungen IC' führt.

10

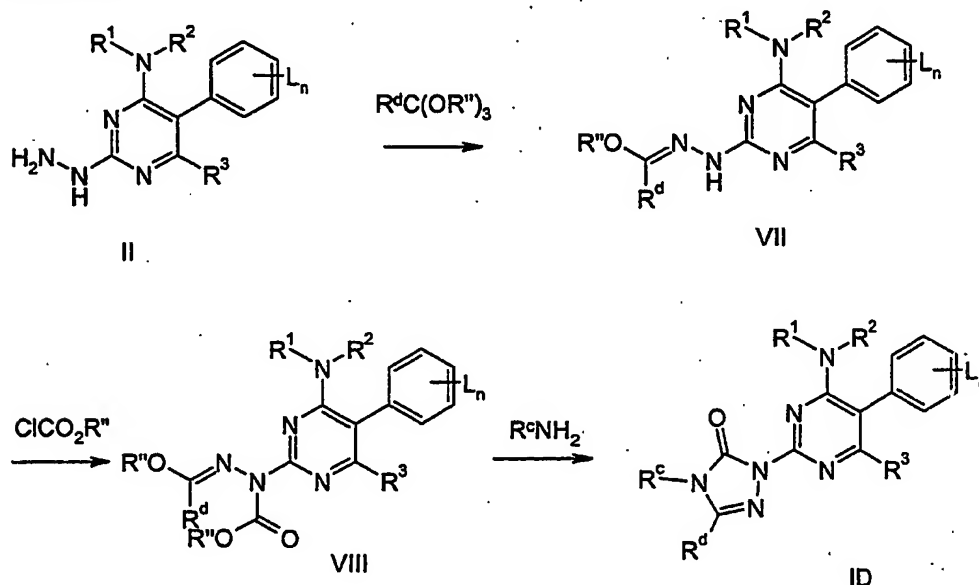


Die Alkylierung der Verbindungen IC mit Alkylierungsmittel  $R^aX$ , wobei  $R^a$  die o.g. Bedeutung hat und X für eine Abgangsgruppe wie Halogenid oder Sulfat steht, in Gegenwart von Base erfolgt nach DE 3336693.

5

- 3) Triazolidinone des Typs ID lassen sich vorteilhaft wie in Schema 3 gezeigt aufbauen.

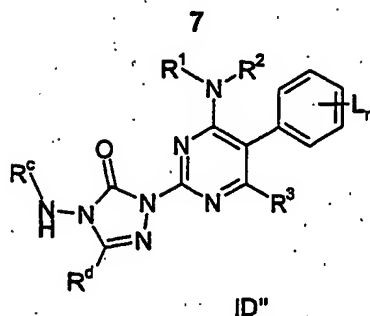
Schema 3:



10

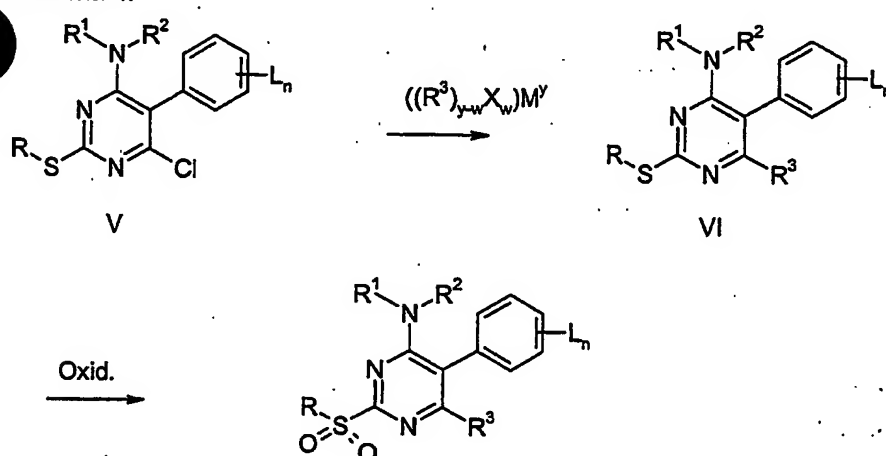
15

Ausgehend von der Hydrazinverbindung II und Orthoestern erhält man die kondensierte Verbindung VII analog der in *J.Am.Chem.Soc.* 1995, 77, S.1148 beschriebenen Methode. VII wird weiterhin mit Chlorameisensäureester zu VIII analog zu der in *Compt. Rend. Acad. Sci.* 1981, 293, N8, 573-76 beschriebenen Methode acyliert. R'' im Orthoester und Chlorameisensäureester bedeutet C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl. Der Ringschluss zu den erfindungsgemäßen Verbindungen ID erfolgt in Gegenwart von Aminen R<sup>c</sup>NH<sub>2</sub>. Werden anstelle von Aminen Hydrazine der Formel R<sup>c</sup>NH-NH<sub>2</sub> eingesetzt, so werden Triazolidinone der Formel ID'' erhalten.



- Der Rest  $R^3$  (insbesondere Alkyl) in 6-Position am Pyrimidinring kann durch Umsetzung unter Übergangsmetallkatalyse, wie Ni- oder Pd-Katalyse eingeführt werden. In manchen Fällen kann es ratsam sein die Reihenfolge umzudrehen und den Substituenten  $R^3$  vor dem Substituenten  $NR^1R^2$  einzuführen.

Schema 4:



10

- In Formel  $(R^3)_wX_wM^Y$  steht M für ein Metallion der Wertigkeit Y, wie beispielsweise B, Zn, Mg, Cu oder Sn, X steht für Chlor, Brom, Iod oder Hydroxy,  $R^3$  bedeutet bevorzugt  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl und w steht für eine Zahl von 0 bis 3. Diese Reaktion kann beispielsweise analog folgender Methoden durchgeführt werden: J. Chem. Soc. Perkin Trans. 1, 1187 (1994), ebenda 1, 2345 (1996); WO-A 99/41255; Aust. J. Chem., Bd. 43, 733 (1990); J. Org. Chem., Bd. 43, 358 (1978); J. Chem. Soc. Chem. Commun. 866 (1979); Tetrahedron Lett., Bd. 34, 8267 (1993); ebenda, Bd. 33, 413 (1992).

- Die obengenannten Angaben beziehen sich insbesondere auf die Herstellung von Verbindungen, in denen  $R^3$  eine Alkylgruppe darstellt. Sofern  $R^3$  eine Cyangruppe oder einen Alkoxy substituenten bedeutet, kann der Rest  $R^3$  durch Umsetzung mit Alkalimetallcyaniden bzw. Alkalimetallalkoholaten eingeführt werden.

Bei den in den vorstehenden Formeln angegebenen Definitionen der Symbole wurden Sammelbegriffe verwendet, die allgemein repräsentativ für die folgenden Substituenten stehen:

5

**Halogen:** Fluor, Chlor, Brom und Jod;

10

**Alkyl:** gesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 1 bis 4, 6, 8 oder 10 Kohlenstoffatomen, z.B. C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl wie Methyl, Ethyl, Propyl, 1-Methylethyl, Butyl, 1-Methyl-propyl, 2-Methylpropyl, 1,1-Dimethylethyl, Pentyl, 1-Methylbutyl, 2-Methylbutyl, 3-Methylbutyl, 2,2-Di-methylpropyl, 1-Ethylpropyl, Hexyl, 1,1-Dimethylpropyl, 1,2-Dimethylpropyl, 1-Methylpentyl, 2-Methylpentyl, 3-Methylpentyl, 4-Methylpentyl, 1,1-Dimethylbutyl, 1,2-Dimethylbutyl, 1,3-Dimethylbutyl, 2,2-Dimethylbutyl, 2,3-Dimethylbutyl, 3,3-Dimethylbutyl, 1-Ethylbutyl, 2-Ethylbutyl, 1,1,2-Trimethylpropyl, 1,2,2-Trimethylpropyl, 1-Ethyl-1-methylpropyl und 1-Ethyl-2-methylpropyl;

15

**Halogenalkyl:** geradkettige oder verzweigte Alkylgruppen mit 1 bis 10 Kohlenstoffatomen (wie vorstehend genannt), wobei in diesen Gruppen teilweise oder vollständig die Wasserstoffatome durch Halogenatome wie vorstehend genannt ersetzt sein können, z.B. C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Halogenalkyl wie Chlormethyl, Brommethyl, Dichlormethyl, Trichlormethyl, Fluormethyl, Difluormethyl, Trifluormethyl, Chlorfluormethyl, Dichlorfluormethyl, Chlor-difluormethyl, 1-Chlorethyl, 1-Bromethyl, 1-Fluorethyl, 2-Fluorethyl, 2,2-Difluorethyl, 2,2,2-Trifluorethyl, 2-Chlor-2-fluorethyl, 2-Chlor-2,2-difluorethyl, 2,2-Dichlor-2-fluorethyl, 2,2,2-Trichlorethyl, Pentafluorethyl oder 1,1,1-Trifluorprop-2-yl;

20

25

**Alkenyl:** ungesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 2 bis 4, 6, 8 oder 10 Kohlenstoffatomen und einer Doppelbindung in einer beliebigen Position, z.B. C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl wie Ethenyl, 1-Propenyl, 2-Propenyl, 1-Methylethenyl, 1-Butenyl, 2-Butenyl, 3-Butenyl, 1-Methyl-1-propenyl, 2-Methyl-1-propenyl, 1-Methyl-2-propenyl, 2-Methyl-2-propenyl, 1-Pentenyl, 2-Pentenyl, 3-Pentenyl, 4-Pentenyl, 1-Methyl-1-butenyl, 2-Methyl-1-butenyl, 3-Methyl-1-butenyl, 1-Methyl-2-butenyl, 2-Methyl-2-butenyl, 3-Methyl-2-butenyl, 1-Methyl-3-butenyl, 2-Methyl-3-butenyl, 3-Methyl-3-butenyl, 1,1-Dimethyl-2-propenyl, 1,2-Dimethyl-1-propenyl, 1,2-Dimethyl-2-propenyl, 1-Ethyl-1propenyl, 1-Ethyl-2-propenyl, 1-Hexenyl, 2-Hexenyl, 3-Hexenyl, 4-Hexenyl, 5-Hexenyl, 1-Methyl-1-pentenyl, 2-Methyl-1-pentenyl, 3-Methyl-1-pentenyl, 4-Methyl-1-pentenyl, 1-Methyl-2-pentenyl, 2-Methyl-2-pentenyl, 3-Methyl-2-pentenyl, 4-Methyl-2-pentenyl, 1-Methyl-3-pentenyl, 2-Methyl-3-pentenyl, 3-Methyl-3-pentenyl, 4-Methyl-3-pentenyl, 1-Methyl-4-pentenyl, 2-Methyl-4-pentenyl, 3-Methyl-4-pentenyl, 4-Methyl-4-pentenyl, 1,1-Dimethyl-2-butenyl, 1,1-Dimethyl-3-butenyl, 1,2-Dimethyl-1-butenyl, 1,2-

30

35

40



Dimethyl-2-butenyl, 1,2-Dimethyl-3-butenyl, 1,3-Dimethyl-1-butenyl, 1,3-Dimethyl-2-butenyl, 1,3-Dimethyl-3-butenyl, 2,2-Dimethyl-3-butenyl, 2,3-Dimethyl-1-butenyl, 2,3-Dimethyl-2-butenyl, 2,3-Dimethyl-3-butenyl, 3,3-Dimethyl-1-butenyl, 3,3-Dimethyl-2-butenyl, 1-Ethyl-1-butenyl, 1-Ethyl-2-butenyl, 1-Ethyl-3-butenyl, 2-Ethyl-1-butenyl, 2-Ethyl-2-butenyl, 2-Ethyl-3-butenyl, 1,1,2-Trimethyl-2-propenyl, 1-Ethyl-1-methyl-2-propenyl, 1-Ethyl-2-methyl-1propenyl und 1-Ethyl-2-methyl-2-propenyl;

10 **Alkadienyl:** ungesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 4, 6, 8 oder 10 Kohlenstoffatomen und zwei Doppelbindungen in beliebiger Position;

**Halogenalkenyl:** ungesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 2 bis 10 Kohlenstoffatomen und einer Doppelbindung in einer beliebigen Position (wie vorstehend genannt), wobei in diesen Gruppen die Wasserstoffatome teilweise oder vollständig gegen Halogenatome wie vorstehend genannt, insbesondere Fluor, Chlor und Brom, ersetzt sein können;

20 **Alkinyl:** geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffgruppen mit 2 bis 4, 6, 8 oder 10 Kohlenstoffatomen und einer Dreifachbindung in einer beliebigen Position, z.B. C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkinyl wie Ethinyl, 1-Propinyl, 2-Propinyl, 1-Butinyl, 2-Butinyl, 3-Butinyl, 1-Methyl-2-propinyl, 1-Pentinyl, 2-Pentinyl, 3-Pentinyl, 4-Pentinyl, 1-Methyl-2-butinyl, 1-Methyl-3-butinyl, 2-Methyl-3-butinyl, 3-Methyl-1-butinyl, 1,1-Dimethyl-2-propinyl, 1-Ethyl-2-propinyl, 1-Hexinyl, 2-Hexinyl, 3-Hexinyl, 4-Hexinyl, 5-Hexinyl, 1-Methyl-2-pentinyl, 1-Methyl-3-pentinyl, 1-Methyl-4-pentinyl, 2-Methyl-3-pentinyl, 2-Methyl-4-pentinyl, 3-Methyl-1-pentinyl, 3-Methyl-4-pentinyl, 4-Methyl-1-pentinyl, 4-Methyl-2-pentinyl, 1,1-Dimethyl-2-butinyl, 1,1-Dimethyl-3-butinyl, 1,2-Dimethyl-3-butinyl, 2,2-Dimethyl-3-butinyl, 3,3-Dimethyl-1-butinyl, 1-Ethyl-2-butinyl, 1-Ethyl-3-butinyl, 2-Ethyl-3-butinyl und 1-Ethyl-1-methyl-2-propinyl;

30 **Cycloalkyl:** mono- oder bicyclische, gesättigte Kohlenwasserstoffgruppen mit 3 bis 6 oder 8 Kohlenstoffringgliedern, z.B. C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Cycloalkyl wie Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cycloheptyl und Cyclooctyl;

fünf- bis sechsgliedriger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S:

35

- **5- oder 6-gliedriges Heterocyclyl,** enthaltend ein bis drei Stickstoffatome und/oder ein Sauerstoff- oder Schwefelatom oder ein oder zwei Sauerstoff- und/oder Schwefelatome, z.B. 2-Tetrahydrofuranyl, 3-Tetrahydrofuranyl, 2-Tetrahydrothienyl, 3-Tetrahydrothienyl, 2-Pyrrolidinyl, 3-Pyrrolidinyl, 3-Isoxazolidinyl, 4-Isoxazolidinyl, 5-Isoxazolidinyl, 3-Isotiazolidinyl, 4-

40

## 10

5 Isothiazolidinyl, 5-Isothiazolidinyl, 3-Pyrazolidinyl, 4-Pyrazolidinyl, 5-Pyrazolidinyl, 2-Oxazolidinyl, 4-Oxazolidinyl, 5-Oxazolidinyl, 2-Thiazolidinyl, 4-Thiazolidinyl, 5-Thiazolidinyl, 2-Imidazolidinyl, 4-Imidazolidinyl, 1,2,4-Oxadiazolidin-3-yl, 1,2,4-Oxadiazolidin-5-yl, 1,2,4-Thiadiazolidin-3-yl, 1,2,4-Thiadiazolidin-5-yl, 1,2,4-Triazolidin-3-yl, 1,3,4-Oxadiazolidin-2-yl, 1,3,4-Thiadiazolidin-2-yl, 1,3,4-Triazolidin-2-yl, 2,3-Dihydrofur-2-yl, 2,3-Dihydrofur-3-yl, 2,4-Dihydrofur-2-yl, 2,4-Dihydrofur-3-yl, 2,3-Dihydrothien-2-yl, 2,3-Dihydrothien-3-yl, 2,4-Dihydrothien-2-yl, 2,4-Dihydrothien-3-yl, 2-Pyrrolin-2-yl, 2-Pyrrolin-3-yl, 3-Pyrrolin-2-yl, 3-Pyrrolin-3-yl, 2-Isloxazolin-3-yl, 3-Isloxazolin-3-yl, 4-Isloxazolin-3-yl, 2-Isloxazolin-4-yl, 3-Isloxazolin-4-yl, 4-Isloxazolin-4-yl, 2-Isloxazolin-5-yl, 3-Isloxazolin-5-yl, 4-Isloxazolin-5-yl, 2-Issothiazolin-3-yl, 3-Issothiazolin-3-yl, 4-Issothiazolin-3-yl, 2-Issothiazolin-4-yl, 3-Issothiazolin-4-yl, 4-Issothiazolin-4-yl, 2-Issothiazolin-5-yl, 3-Issothiazolin-5-yl, 4-Issothiazolin-5-yl, 2,3-Dihydropyrazol-1-yl, 2,3-Dihydropyrazol-2-yl, 2,3-Dihydropyrazol-3-yl, 2,3-Dihydropyrazol-4-yl, 2,3-Dihydropyrazol-5-yl, 3,4-Dihydropyrazol-1-yl, 3,4-Dihydropyrazol-3-yl, 3,4-Dihydropyrazol-4-yl, 3,4-Dihydropyrazol-5-yl, 4,5-Dihydropyrazol-1-yl, 4,5-Dihydropyrazol-3-yl, 4,5-Dihydropyrazol-4-yl, 4,5-Dihydropyrazol-5-yl, 2,3-Dihydrooxazol-2-yl, 2,3-Dihydrooxazol-3-yl, 2,3-Dihydrooxazol-4-yl, 2,3-Dihydrooxazol-5-yl, 3,4-Dihydrooxazol-2-yl, 3,4-Dihydrooxazol-3-yl, 3,4-Dihydrooxazol-4-yl, 3,4-Dihydrooxazol-5-yl, 3,4-Dihydrooxazol-2-yl, 3,4-Dihydrooxazol-3-yl, 3,4-Dihydrooxazol-4-yl, 2-Piperidinyl, 3-Piperidinyl, 4-Piperidinyl, 1,3-Dioxan-5-yl, 2-Tetrahydropyranyl, 4-Tetrahydropyranyl, 2-Tetrahydrothienyl, 3-Hexahydropyridazinyl, 4-Hexahydropyridazinyl, 2-Hexahydropyrimidinyl, 4-Hexahydropyrimidinyl, 5-Hexahydropyrimidinyl, 2-Piperazinyl, 1,3,5-Hexahydrotriazin-2-yl und 1,2,4-Hexahydrotriazin-3-yl;

5-gliedriges Heteroaryl, enthaltend ein bis vier Stickstoffatome oder ein bis drei Stickstoffatome und ein Schwefel- oder Sauerstoffatom: 5-Ring Heteroarylgruppen, welche neben Kohlenstoffatomen ein bis vier Stickstoffatome oder ein bis drei Stickstoffatome und ein Schwefel- oder Sauerstoffatom als Ringglieder enthalten können, z.B. 2-Furyl, 3-Furyl, 2-Thienyl, 3-Thienyl, 2-Pyrrolyl, 3-Pyrrolyl, 3-Isloxazolyl, 4-Isloxazolyl, 5-Isloxazolyl, 3-Issothiazolyl, 4-Issothiazolyl, 5-Issothiazolyl, 3-Pyrazolyl, 4-Pyrazolyl, 5-Pyrazolyl, 2-Oxazolyl, 4-Oxazolyl, 5-Oxazolyl, 2-Thiazolyl, 4-Thiazolyl, 5-Thiazolyl, 2-Imidazolyl, 4-Imidazolyl, 1,2,4-Oxadiazol-3-yl, 1,2,4-Oxadiazol-5-yl, 1,2,4-Thiadiazol-3-yl, 1,2,4-Thiadiazol-5-yl, 1,2,4-Triazol-3-yl, 1,3,4-Oxadiazol-2-yl, 1,3,4-Thiadiazol-2-yl und 1,3,4-Triazol-2-yl;

6-gliedriges Heteroaryl, enthaltend ein bis drei bzw. ein bis vier Stickstoffatome: 6-Ring Heteroarylgruppen, welche neben Kohlenstoffatomen ein bis drei bzw. ein bis vier Stickstoffatome als Ringglieder enthalten können, z.B. 2-Pyridinyl, 3-

Pyridinyl, 4-Pyridinyl, 3-Pyridazinyl, 4-Pyridazinyl, 2-Pyrimidinyl, 4-Pyrimidinyl, 5-Pyrimidinyl, 2-Pyrazinyl, 1,3,5-Triazin-2-yl und 1,2,4-Triazin-3-yl;

5 In dem Umfang der vorliegenden Erfindung sind die (R)- und (S)-Isomere und die Racemate ( $\pm$ ) von Verbindungen der Formel I eingeschlossen, die chirale Zentren aufweisen.

Im folgenden werden die Ausführungsformen der Erfindung genauer beschrieben.

10 Im Hinblick auf die bestimmungsgemäße Verwendung der Pyrimidine der Formel I sind die folgenden Bedeutungen der Substituenten, und zwar jeweils für sich allein oder in Kombination, besonders bevorzugt:

Verbindungen I werden bevorzugt, in denen  $R^1$  für einen  $C_1$ - $C_6$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkyl,  $C_2$ - $C_6$ -Alkenyl,  $C_2$ - $C_6$ -Alkynyl oder  $C_3$ - $C_6$ -Cycloalkyl und  $R^2$  für Wasserstoff stehen.

Insbesondere werden Verbindungen I bevorzugt, in denen  $R^1$  für in  $\alpha$ -Stellung verzweigtes  $C_1$ - $C_6$ -Alkyl oder  $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkyl steht.

20

Daneben werden Verbindungen I bevorzugt, in denen  $R^1$  für  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkyl und  $R^2$  für Wasserstoff stehen.

25 Außerdem werden Verbindungen I bevorzugt, in denen  $R^1$  und  $R^2$  zusammen mit dem Stickstoff, an das sie gebunden sind, einen fünf- oder sechsgliedrigen Ring bilden, der durch ein Sauerstoffatom unterbrochen sein kann und einen oder zwei  $C_1$ - $C_6$ -Alkylsubstituenten tragen kann.

30 Insbesondere bevorzugt sind Gruppen  $NR^1R^2$  wie – insbesondere in  $\alpha$ -Stellung – methylierte Pyrrolidine oder Piperidine.

Außerdem werden Pyrimidine I besonders bevorzugt, wobei der Index n und die Substituenten  $L^1$  bis  $L^5$  die folgende Bedeutung haben:

35 n 1 bis 3

L Halogen; Cyano,  $C_1$ - $C_6$ -Alkyl,  $C_2$ - $C_{10}$ -Alkenyl,  $C_2$ - $C_{10}$ -Alkynyl,  $C_1$ - $C_6$ -Alkoxy,  $C_2$ - $C_{10}$ -Alkenyloxy,  $C_2$ - $C_{10}$ -Alkynyloxy,  $C_3$ - $C_6$ -Cycloalkyl,  $C_3$ - $C_6$ -Cycloalkenyl,  $C_3$ - $C_6$ -Cycloalkoxy,  $-C(=O)-O-A$ ,  $-C(=O)-N(A')A$ ,  $C(A')(=N-OA)$ ,  $N(A')A$ ,  $N(A')-C(=O)-A$  oder  $S(=O)_m-A$ ;

m 0, 1 oder 2;

A, A', A'' unabhängig voneinander Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkynyl, wobei die organischen Reste partiell oder vollständig halogeniert sein können oder durch Cyano oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy substituiert sein können, oder A und A' zusammen mit den Atomen, an die sie gebunden sind für einen fünf- bis sechsgliedrigen gesättigten Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N, oder S, stehen.

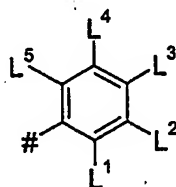
Insbesondere werden Pyrimidine I bevorzugt, wobei die Substituenten L<sup>1</sup> bis L<sup>5</sup> die folgende Bedeutung haben:

L Halogen, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, -C(=O)-O-A, -C(=O)-N(A')A,  
m 0, 1 oder 2;  
A, A', A'' unabhängig voneinander Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkynyl.

Verbindungen I werden besonders bevorzugt, in denen R<sup>u</sup> für Halogen, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>-Alkynyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>-Alkenyloxy, C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>-Alkynyloxy, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkenyl, -C(=O)-O-A, -C(=O)-N(A')A, C(A') (=N-OA) steht, wobei die aliphatischen oder alicyclischen Gruppen ihrerseits partiell oder vollständig halogeniert sein oder eine bis drei Gruppen R<sup>v</sup> tragen können, wobei R<sup>v</sup> die gleiche Bedeutung wie R<sup>u</sup> besitzt.

Insbesondere werden Verbindungen I bevorzugt, in denen R<sup>u</sup> für Halogen, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkynyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyloxy, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkynyloxy, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkenyl, steht.

Außerdem werden Pyrimidine I bevorzugt, wobei die durch L<sub>n</sub> substituierte Phenylgruppe für die Gruppe B



B

steht, worin # die Verknüpfungsstelle mit dem Pyrimidin-Gerüst ist und

L<sup>1</sup> Fluor, Chlor, CH<sub>3</sub> oder CF<sub>3</sub>;

L<sup>2</sup>, L<sup>4</sup> unabhängig voneinander Wasserstoff, CH<sub>3</sub> oder Fluor;

13

- $L^3$  Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Cyano,  $CH_3$ ,  $SCH_3$ ,  $OCH_3$ ,  $SO_2CH_3$ ,  $CO-NH_2$ ,  $CO-NHCH_3$ ,  $CO-NHC_2H_5$ ,  $CO-N(CH_3)_2$ ,  $NH-C(=O)CH_3$ ,  $N(CH_3)-C(=O)CH_3$  oder  $COOCH_3$  und
- $L^5$  Wasserstoff, Fluor, Chlor oder  $CH_3$  bedeuten.

5

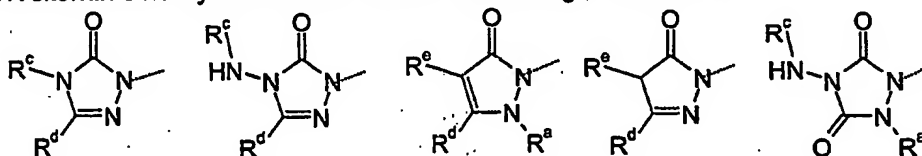
Besonders bevorzugt werden auch Verbindungen I, in denen  $R^3$   $C_1$ - $C_4$ -Alkyl bedeutet, das durch Halogen substituiert sein kann.

10

Außerdem werden Verbindungen I besonders bevorzugt, in denen  $R^3$  für Halogen, Cyano,  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl oder  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxy steht.

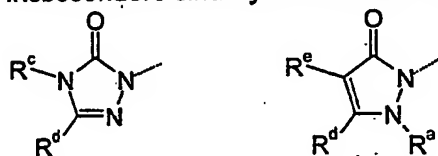
Insbesondere werden Verbindungen I bevorzugt, in denen  $R^3$  Methyl, Ethyl, Cyano, Brom oder insbesondere Chlor bedeutet.

Weiterhin sind Pyrimidine der Formel I bevorzugt, in der  $R^4$  für



steht.

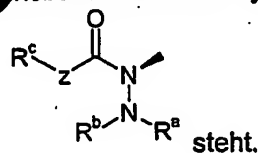
Insbesondere sind Pyrimidine der Formel I bevorzugt, in der  $R^4$  für



20

steht.

Insbesondere sind Pyrimidine der Formel I bevorzugt, in der  $R^4$  für Formel



steht.

25

$R^a$ ,  $R^b$  und  $R^c$  bedeuten vorzugsweise unabhängig voneinander Wasserstoff,  $C_1$ - $C_6$ -Alkyl,  $C_2$ - $C_6$ -Alkenyl,  $C_2$ - $C_6$ -Alkynyl oder  $C_3$ - $C_6$ -Cycloalkyl.

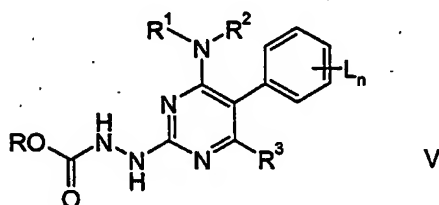
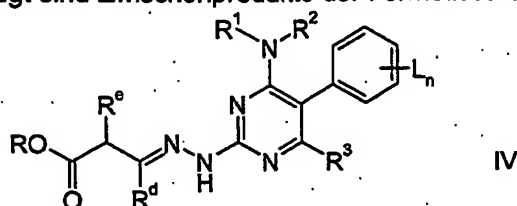
30

Bevorzugt bedeuten  $R^a$ ,  $R^b$  und  $R^c$  unabhängig voneinander Wasserstoff, Methyl oder Ethyl.

Für die Zwischenprodukte der Formel IV, V, VI und VII gelten die gleichen Bevorzugungen wie für die Wirkstoffe die zuvor genannt wurden. Dabei gelten die bevorzugten Substituentenbedeutungen jeweils für sich wie auch in Kombination mit anderen Bevorzugungen.

5

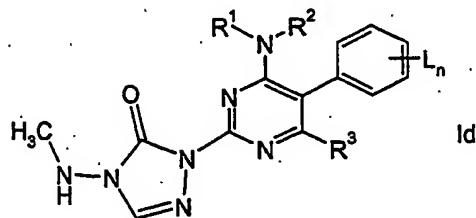
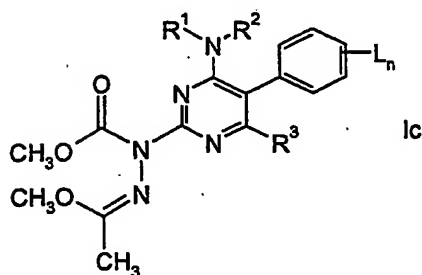
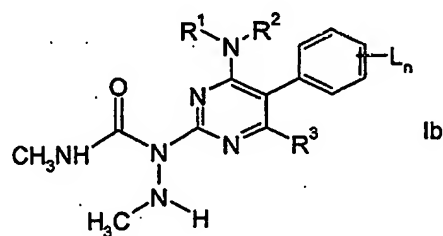
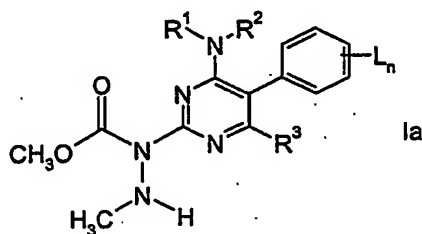
Insbesondere bevorzugt sind Zwischenprodukte der Formeln IV und V.



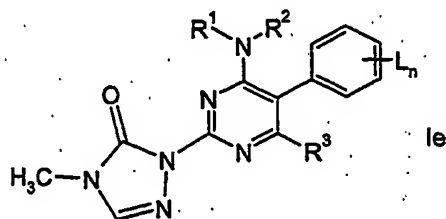
10

Insbesondere sind im Hinblick auf ihre Verwendung die in den folgenden Tabellen zusammengestellten Verbindungen I bevorzugt. Die in den Tabellen für einen Substituenten genannten Gruppen stellen außerdem für sich betrachtet, unabhängig von der Kombination, in der sie genannt sind, eine besonders bevorzugte Ausgestaltung des betreffenden Substituenten dar.

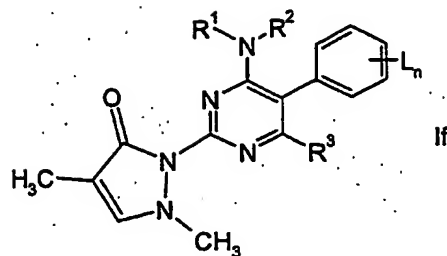
15



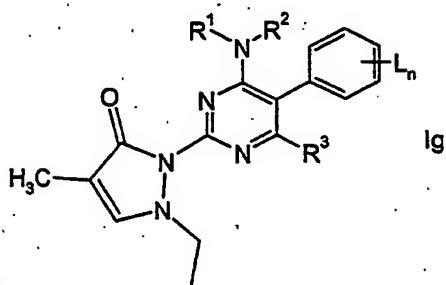
15



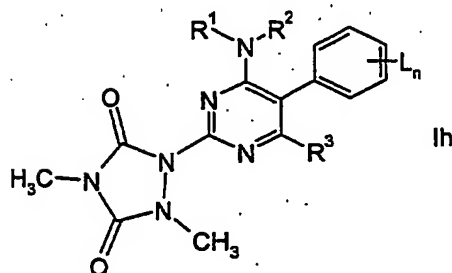
1e



1f



1g



1h

Verbindungen der Formel 1a, 1b, 1c, 1d, 1e, 1f, 1g und 1h, in denen  $L_n$  2-Fluor, 6-chlor,  $R^3$  Methyl bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

#### Tabelle 1

Verbindungen der Formel 1a, 1b, 1c, 1d, 1e, 1f, 1g und 1h, in denen  $L_n$  2,6-Difluor,  $R^3$  Methyl bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10

#### Tabelle 2

Verbindungen der Formel 1a, 1b, 1c, 1d, 1e, 1f, 1g und 1h, in denen  $L_n$  2,6-Dichlor,  $R^3$  Methyl bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

#### Tabelle 3

Verbindungen der Formel 1a, 1b, 1c, 1d, 1e, 1f, 1g und 1h, in denen  $L_n$  2-Fluor, 6-methyl,  $R^3$  Methyl bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

20

#### Tabelle 4

Verbindungen der Formel 1a, 1b, 1c, 1d, 1e, 1f, 1g und 1h, in denen  $L_n$  2,4,6-Trifluor,  $R^3$  Methyl bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

25

## Tabelle 5

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2-Methyl,4-fluor,  $R^3$  Methyl bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

## Tabelle 6

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2-Fluor,4-methoxycarbonyl,  $R^3$  Methyl bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10

## Tabelle 7

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2-Fluor,4-CN,  $R^3$  Methyl bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

15

## Tabelle 8

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2,4,5-Trifluor,  $R^3$  Methyl bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

20

## Tabelle 9

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2,4-Dichlor,  $R^3$  Methyl bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

25

## Tabelle 10

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2-Chlor,  $R^3$  Methyl bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

30

## Tabelle 11

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2-Fluor,  $R^3$  Methyl bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 12

35 Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2,4-Difluor,  $R^3$  Methyl bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht



## Tabelle 13

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2-Fluor-4-chlor,  $R^3$  Methyl bedeuten und  $R^1, R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

## Tabelle 14

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2-Chlor-4-fluor,  $R^3$  Methyl bedeuten und  $R^1, R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10

## Tabelle 15

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2,3-Difluor,  $R^3$  Methyl bedeuten und  $R^1, R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 16

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2,5-Difluor,  $R^3$  Methyl bedeuten und  $R^1, R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

20

## Tabelle 17

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2,3,4-Trifluor,  $R^3$  Methyl bedeuten und  $R^1, R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

25

## Tabelle 18

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2-Methyl,  $R^3$  Methyl bedeuten und  $R^1, R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## 30 Tabelle 19

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2,4-Dimethyl,  $R^3$  Methyl bedeuten und  $R^1, R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## 35 Tabelle 20

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2-Methyl-4-chlor,  $R^3$  Methyl bedeuten und  $R^1, R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 21

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2-Fluor-4-methyl,  $R^3$  Methyl bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

## Tabelle 22

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2,6-Dimethyl,  $R^3$  Methyl bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10

## Tabelle 23

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2,4,6-Trimethyl,  $R^2$  Methyl bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

15

## Tabelle 24

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2,6-Difluor-4-cyano,  $R^2$  Methyl bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

20

## Tabelle 25

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2,6-Difluor-4-methyl,  $R^2$  Methyl bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

25

## Tabelle 26

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2,6-Difluor-4-methoxycarbonyl,  $R^2$  Methyl bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

30

## Tabelle 27

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2-Chlor,4-Methoxy,  $R^2$  Methyl bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

35

## Tabelle 28

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2-Chlor,4-Methyl,  $R^2$  Methyl bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 29

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2-Chlor, 4-methoxycarbonyl,  $R^2$  Methyl bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

## Tabelle 30

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2-Chlor, 4-Brom,  $R^3$  Methyl bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10

## Tabelle 31

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2-Chlor, 4-Cyan,  $R^3$  Methyl bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 32

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2,6-Difluor, 4-methoxy,  $R^3$  Methyl bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

20

## Tabelle 33

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2-Fluor, 3-methyl,  $R^3$  Methyl bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

25

## Tabelle 34

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2,5-Dimethyl,  $R^3$  Methyl bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

30

## Tabelle 35

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2-Methyl, 4-Cyan,  $R^3$  Methyl bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

35

## Tabelle 36

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$ -2-Methyl,4-brom,  $R^3$  Methyl bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

## Tabelle 37

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$ -2-Methyl,5-fluor,  $R^3$  Methyl bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10

## Tabelle 38

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$ -2-Methyl,4-methoxy,  $R^3$  Methyl bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

15

## Tabelle 39

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$ -2-Methyl,4-methoxycarbonyl,  $R^3$  Methyl bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

20

## Tabelle 40

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$ -2,5-Dimethyl,4-brom,  $R^3$  Methyl bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

25

## Tabelle 41

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$ -2-Fluor,4-brom,  $R^3$  Methyl bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

30

## Tabelle 42

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$ -2-Fluor,4-methoxy,  $R^2$  Methyl bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

35

## Tabelle 43

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$ -2-Fluor,5-methyl,  $R^3$  Methyl bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 44

- Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  Pentafluor,  $R^3$  Methyl bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht
- 5.

## Tabelle 45

- Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2-Fluor,6-chlor,  $R^3$  Chlor bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht
- 10

## Tabelle 46

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2,6-Difluor,  $R^3$  Chlor bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 47

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2,6-Dichlor,  $R^3$  Chlor bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## 20 Tabelle 48

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2-Fluor,6-methyl,  $R^3$  Chlor bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## 25 Tabelle 49

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2,4,6-Trifluor,  $R^3$  Chlor bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## 30 Tabelle 50

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2-Methyl,4-fluor,  $R^3$  Chlor bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## 35 Tabelle 51

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2-Fluor,4-methoxycarbonyl,  $R^3$  Chlor bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 52

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2-Fluor,4-CN,  $R^3$  Chlor bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

## Tabelle 53

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2,4,5-Trifluor,  $R^3$  Chlor bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10

## Tabelle 54

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2,4-Dichlor,  $R^3$  Chlor bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

15

## Tabelle 55

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2-Chlor,  $R^3$  Chlor bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 56

20 Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2-Fluor,  $R^3$  Chlor bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 57

25 Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2,4-Difluor,  $R^3$  Chlor bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 58

30 Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2-Fluor-4-chlor,  $R^3$  Chlor bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 59

35 Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2-Chlor-4-fluor,  $R^3$  Chlor bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 60

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2,3-Difluor,  $R^3$  Chlor bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 61

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2,5-Difluor,  $R^3$  Chlor bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

## Tabelle 62

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2,3,4-Trifluor,  $R^3$  Chlor bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10

## Tabelle 63

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2-Methyl,  $R^3$  Chlor bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 64

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2,4-Dimethyl,  $R^3$  Chlor bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## 20 Tabelle 65

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2-Methyl-4-chlor,  $R^3$  Chlor bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## 25 Tabelle 66

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2-Fluor-4-methyl,  $R^2$  Chlor bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## 30 Tabelle 67

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2,6-Dimethyl,  $R^3$  Chlor bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## 35 Tabelle 68

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2,4,6-Trimethyl,  $R^3$  Chlor bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 69

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2,6-Difluor-4-cyano,  $R^3$  Chlor bedeuten und  $R^1, R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

## Tabelle 70

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2,6-Difluor-4-methyl,  $R^3$  Chlor bedeuten und  $R^1, R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10

## Tabelle 71

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2,6-Difluor-4-methoxycarbonyl,  $R^3$  Chlor bedeuten und  $R^1, R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

15

## Tabelle 72

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2-Chlor,4-Methoxy,  $R^3$  Chlor bedeuten und  $R^1, R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

20

## Tabelle 73

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2-Chlor,4-Methyl,  $R^3$  Chlor bedeuten und  $R^1, R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

25

## Tabelle 74

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2-Chlor,4-methoxycarbonyl,  $R^3$  Chlor bedeuten und  $R^1, R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

30

## Tabelle 75

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2-Chlor,4-Brom,  $R^3$  Chlor bedeuten und  $R^1, R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

35

## Tabelle 76

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2-Chlor,4-Cyan,  $R^3$  Chlor bedeuten und  $R^1, R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht



## Tabelle 77

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2,6-Difluor,4-methoxy,  $R^3$  Chlor bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

## Tabelle 78

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2-Fluor,3-methyl,  $R^3$  Chlor bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10

## Tabelle 79

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2,5-Dimethyl,  $R^3$  Chlor bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 80

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2-Methyl,4-cyan,  $R^3$  Chlor bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

20

## Tabelle 81

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2-Methyl,4-brom,  $R^3$  Chlor bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

25

## Tabelle 82

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2-Methyl,5-fluor,  $R^3$  Chlor bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

30

## Tabelle 83

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2-Methyl,4-methoxy,  $R^3$  Chlor bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

35

## Tabelle 84

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$ -2-Methyl,4-methoxycarbonyl,  $R^3$  Chlor bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

## Tabelle 85

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$ -2,5-Dimethyl,4-brom,  $R^3$  Chlor bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10

## Tabelle 86

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$ -2-Fluor,4-brom,  $R^3$  Chlor bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

15

## Tabelle 87

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$ -2-Fluor,4-methoxy,  $R^3$  Chlor bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

20

## Tabelle 88

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$ -2-Fluor,5-methyl,  $R^3$  Chlor bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

25

## Tabelle 89

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$ -Pentafluor,  $R^3$  Chlor bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

30

## Tabelle 90

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$ -2-Fluor,6-chlor,  $R^3$  Brom bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

35

## Tabelle 91

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$ -2,6-Difluor,  $R^3$  Brom bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 92

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2,6-Dichlor,  $R^3$  Brom bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## 5 Tabelle 93

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2-Fluor,6-methyl,  $R^3$  Brom bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## 10 Tabelle 94

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2,4,6-Trifluor,  $R^3$  Brom bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 95

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2-Methyl,4-fluor,  $R^3$  Brom bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## 20 Tabelle 96

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2-Fluor,4-methoxycarbonyl,  $R^3$  Brom bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## 25 Tabelle 97

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2-Fluor,4-CN,  $R^3$  Brom bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## 30 Tabelle 98

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2,4,5-Trifluor,  $R^3$  Brom bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## 35 Tabelle 99

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2,4-Dichlor,  $R^3$  Brom bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 100

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2-Chlor,  $R^3$  Brom bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## 5 Tabelle 101

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2-Fluor,  $R^3$  Brom bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 102

- 10 Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2,4-Difluor,  $R^3$  Brom bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 103

- 15 Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2-Fluor-4-chlor,  $R^3$  Brom bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 104

- 20 Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2-Chlor-4-fluor,  $R^3$  Brom bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 105

- 25 Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2,3-Difluor,  $R^3$  Brom bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 106

- 30 Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2,5-Difluor,  $R^3$  Brom bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 107

- 35 Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2,3,4-Trifluor,  $R^3$  Brom bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 108

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2-Methyl,  $R^3$  Brom bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 109

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2,4-Dimethyl,  $R^3$  Brom bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

## Tabelle 110

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2-Methyl-4-chlor,  $R^3$  Brom bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10

## Tabelle 111

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2-Fluor-4-methyl,  $R^3$  Brom bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 112

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2,6-Dimethyl,  $R^3$  Brom bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

20

## Tabelle 113

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2,4,6-Trimethyl,  $R^3$  Brom bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

25

## Tabelle 114

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2,6-Difluor-4-cyano,  $R^3$  Brom bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

30

## Tabelle 115

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2,6-Difluor-4-methyl,  $R^3$  Brom bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

35

## Tabelle 116

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2,6-Difluor-4-Methoxycarbonyl,  $R^3$  Brom bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 117

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2-Chlor,4-Methoxy,  $R^3$  Brom bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

## Tabelle 118

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2-Chlor,4-Methyl,  $R^3$  Brom bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10

## Tabelle 119

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2-Chlor,4-methoxycarbonyl,  $R^3$  Brom bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

15

## Tabelle 120

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2-Chlor,4-Brom,  $R^3$  Brom bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

20

## Tabelle 121

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2-Chlor,4-Cyan,  $R^3$  Brom bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

25

## Tabelle 122

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2,6-Difluor,4-methoxy,  $R^3$  Brom bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

30

## Tabelle 123

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2-Fluor,3-methyl,  $R^3$  Brom bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

35

## Tabelle 124

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2,5-Dimethyl,  $R^3$  Brom bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

## Tabelle 125

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2-Methyl,4-Cyan,  $R^3$  Brom bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10

## Tabelle 126

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2-Methyl,4-brom,  $R^3$  Brom bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 127

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2-Methyl,5-fluor,  $R^3$  Brom bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

20

## Tabelle 128

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2-Methyl,4-methoxy,  $R^3$  Brom bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

25

## Tabelle 129

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2-Methyl,4-methoxycarbonyl,  $R^3$  Brom bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

30

## Tabelle 130

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2,5-Dimethyl,4-brom,  $R^3$  Brom bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

35

## Tabelle 131

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2-Fluor,4-brom,  $R^3$  Brom bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 132

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2-Fluor,4-methoxy,  $R^3$  Brom bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

## Tabelle 133

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2-Fluor,5-methyl,  $R^3$  Brom bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10

## Tabelle 134

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  Pentafluor,  $R^3$  Brom bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

15

## Tabelle 135

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2-Fluor,6-chlor,  $R^3$  Cyano bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

20

## Tabelle 136

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2,6-Difluor,  $R^3$  Cyano bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

25

## Tabelle 137

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2,6-Dichlor,  $R^3$  Cyano bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

30

## Tabelle 138

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2-Fluor,6-methyl,  $R^3$  Cyano bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 139

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2,4,6-Trifluor,  $R^3$  Cyano bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

35



## Tabelle 140

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2-Methyl,4-fluor,  $R^3$  Cyano bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

## Tabelle 141

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2-Fluor,4-methoxycarbonyl,  $R^3$  Cyano bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10

## Tabelle 142

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2-Fluor,4-CN,  $R^3$  Cyano bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 143

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2,4,5-Trifluor,  $R^3$  Cyano bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

20

## Tabelle 144

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2,4-Dichlor,  $R^3$  Cyano bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## 25 Tabelle 145

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2-Chlor,  $R^3$  Cyano bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 146

30 Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2-Fluor,  $R^3$  Cyano bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 147

35 Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2,4-Difluor,  $R^3$  Cyano bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 148

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2-Fluor-4-chlor,  $R^3$  Cyano bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

## Tabelle 149

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2-Chlor-4-fluor,  $R^3$  Cyano bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10

## Tabelle 150

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2,3-Difluor,  $R^3$  Cyano bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

15

## Tabelle 151

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2,5-Difluor,  $R^3$  Cyano bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 152

20 Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2,3,4-Trifluor,  $R^3$  Cyano bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 153

25 Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2-Methyl,  $R^3$  Cyano bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 154

30 Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2,4-Dimethyl,  $R^3$  Cyano bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 155

35 Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2-Methyl-4-chlor,  $R^3$  Cyano bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 156

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2-Fluor-4-methyl,  $R^3$  Cyano bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

## Tabelle 157

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2,6-Dimethyl,  $R^3$  Cyano bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10

## Tabelle 158

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2,4,6-Trimethyl,  $R^3$  Cyano bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 159

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2,6-Difluor-4-cyano,  $R^3$  Cyano bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

20

## Tabelle 160

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2,6-Difluor-4-methyl,  $R^3$  Cyano bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

25

## Tabelle 161

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2,6-Difluor-4-methoxycarbonyl,  $R^3$  Cyano bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

30

## Tabelle 162

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2-Chlor,4-Methoxy,  $R^3$  Cyano bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

35

## Tabelle 163

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2-Chlor,4-Methyl,  $R^3$  Cyano bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 164

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$ -2-Chlor,4-methoxycarbonyl,  $R^3$  Cyano bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer

5 Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 165

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$ -2-Chlor,4-Brom,  $R^3$  Cyano bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10

## Tabelle 166

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$ -2-Chlor,4-Cyan,  $R^3$  Cyano bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

15

## Tabelle 167

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$ -2,6-Difluor,4-methoxy,  $R^3$  Cyano bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der

20

## Tabelle 168

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$ -2-Fluor,3-methyl,  $R^3$  Cyano bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

25

## Tabelle 169

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$ -2,5-Dimethyl,  $R^3$  Cyano bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

30

## Tabelle 170

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$ -2-Methyl,4-cyan,  $R^3$  Cyano bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

35

## Tabelle 171

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2-Methyl,4-brom,  $R^3$  Cyano bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

## Tabelle 172

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2-Methyl,5-fluor,  $R^3$  Cyano bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10

## Tabelle 173

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2-Methyl,4-methoxy,  $R^3$  Cyano bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 174

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2-Methyl,4-methoxycarbonyl,  $R^3$  Cyano bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

20

## Tabelle 175

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2,5-Dimethyl,4-brom,  $R^3$  Cyano bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

25

## Tabelle 176

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2-Fluor,4-brom,  $R^3$  Cyano bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

30

## Tabelle 177

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2-Fluor,4-methoxy,  $R^3$  Cyano bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

35

## Tabelle 178

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen  $L_n$  2-Fluor,5-methyl,  $R^3$  Cyano bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 179

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig und Ih, in denen L<sub>n</sub> Pentafluor, R<sup>3</sup> Cyano bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

Tabelle A

| No.  | R <sup>1</sup>  | R <sup>2</sup>                                  |
|------|---|---|
| A-1  | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                         | H   |
| A-2  | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                         | CH <sub>3</sub>                                 |
| A-3  | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                         | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 |
| A-4  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>         | H   |
| A-5  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>         | CH <sub>3</sub>                                 |
| A-6  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>         | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 |
| A-7  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>         | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |
| A-8  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F                       | H   |
| A-9  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F                       | CH <sub>3</sub>                                 |
| A-10 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F                       | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 |
| A-11 | CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>                         | H   |
| A-12 | CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>                         | CH <sub>3</sub>                                 |
| A-13 | CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>                         | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 |
| A-14 | CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>                         | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |
| A-15 | CH <sub>2</sub> CCl <sub>3</sub>                        | H   |
| A-16 | CH <sub>2</sub> CCl <sub>3</sub>                        | CH <sub>3</sub>                                 |
| A-17 | CH <sub>2</sub> CCl <sub>3</sub>                        | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 |
| A-18 | CH <sub>2</sub> CCl <sub>3</sub>                        | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |
| A-19 | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                       | H   |
| A-20 | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                       | CH <sub>3</sub>                                 |
| A-21 | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                       | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 |
| A-22 | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                       | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |
| A-23 | CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>        | H   |
| A-24 | CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>        | CH <sub>3</sub>                                 |
| A-25 | CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>        | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 |
| A-26 | CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>       | H   |
| A-27 | CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>       | CH <sub>3</sub>                                 |
| A-28 | CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>       | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 |
| A-29 | (±) CH(CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> | H   |
| A-30 | (±) CH(CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>                                 |

|      |  |                                 |
|------|--|---------------------------------|
| A-31 | (±) CH(CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub>    | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |
| A-32 | (R) CH(CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub>    | H                               |
| A-33 | (R) CH(CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub>    | CH <sub>3</sub>                 |
| A-34 | (R) CH(CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub>    | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |
| A-35 | (S) CH(CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub>    | H                               |
| A-36 | (S) CH(CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub>    | CH <sub>3</sub>                 |
| A-37 | (S) CH(CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub>    | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |
| A-38 | (±) CH(CH <sub>3</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | H                               |
| A-39 | (±) CH(CH <sub>3</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | CH <sub>3</sub>                 |
| A-40 | (±) CH(CH <sub>3</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |
| A-41 | (R) CH(CH <sub>3</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | H                               |
| A-42 | (R) CH(CH <sub>3</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | CH <sub>3</sub>                 |
| A-43 | (R) CH(CH <sub>3</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |
| A-44 | (S) CH(CH <sub>3</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | H                               |
| A-45 | (S) CH(CH <sub>3</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | CH <sub>3</sub>                 |
| A-46 | (S) CH(CH <sub>3</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |
| A-47 | (±) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>  | H                               |
| A-48 | (±) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>  | CH <sub>3</sub>                 |
| A-49 | (±) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>  | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |
| A-50 | (R) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>  | H                               |
| A-51 | (R) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>  | CH <sub>3</sub>                 |
| A-52 | (R) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>  | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |
| A-53 | (S) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>  | H                               |
| A-54 | (S) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>  | CH <sub>3</sub>                 |
| A-55 | (S) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>  | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |
| A-56 | (±) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>                   | H                               |
| A-57 | (±) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>                   | CH <sub>3</sub>                 |
| A-58 | (±) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>                   | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |
| A-59 | (R) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>                   | H                               |
| A-60 | (R) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>                   | CH <sub>3</sub>                 |
| A-61 | (R) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>                   | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |
| A-62 | (S) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>                   | H                               |
| A-63 | (S) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>                   | CH <sub>3</sub>                 |
| A-64 | (S) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>                   | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |
| A-65 | (±) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>                  | H                               |
| A-66 | (±) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>                  | CH <sub>3</sub>                 |
| A-67 | (±) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>                  | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |
| A-68 | (R) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>                  | H                               |

|      |   |                                 |
|------|---|---------------------------------|
| A-69 | (R) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>   | CH <sub>3</sub>                 |
| A-70 | (R) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>   | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |
| A-71 | (S) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>   | H                               |
| A-72 | (S) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>   | CH <sub>3</sub>                 |
| A-73 | (S) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>   | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |
| A-74 | CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>   | H                               |
| A-75 | CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>   | CH <sub>3</sub>                 |
| A-76 | CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>   | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |
| A-77 | Cyclopentyl   | H                               |
| A-78 | Cyclopentyl   | CH <sub>3</sub>                 |
| A-79 | Cyclopentyl   | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |
| A-80 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -  |                                 |
| A-81 | (±) -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -  |                                 |
| A-82 | (R) -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -  |                                 |
| A-83 | (S) -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -  |                                 |
| A-84 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(OCH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -   |                                 |
| A-85 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -  |                                 |
| A-86 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH[CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> ]-CH <sub>2</sub> -  |                                 |
| A-87 | (±) -(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-   |                                 |
| A-88 | (±) -CH(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-  |                                 |
| A-89 | -CH <sub>2</sub> -CH=CH-CH <sub>2</sub> -   |                                 |
| A-90 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -  |                                 |
| A-91 | (±) -(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-   |                                 |
| A-92 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -  |                                 |
| A-93 | (±) -(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -  |                                 |
| A-94 | (R) -(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -  |                                 |
| A-95 | (S) -(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -  |                                 |
| A-96 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -C(O[CH <sub>2</sub> ] <sub>2</sub> O)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -                                     |                                 |
| A-97 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -C(O[CH <sub>2</sub> ] <sub>3</sub> O)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -                                     |                                 |
| A-98 | $\text{---}(\text{CH})_2 \begin{array}{c} \text{CH}_2 \\ \diagup \quad \diagdown \\ \text{---} \end{array} \text{---}(\text{CH})_2\text{---}$ |                                 |
| A-99 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH=CH-CH <sub>2</sub> -   |                                 |

- Die Verbindungen I eignen sich als Fungizide. Sie zeichnen sich aus durch eine hervorragende Wirksamkeit gegen ein breites Spektrum von pflanzenpathogenen Pilzen, insbesondere aus der Klasse der *Ascomyceten*, *Deuteromyceten*, *Oomyceten* und *Basidiomyceten*. Sie sind zum Teil systemisch wirksam und können im Pflanzenschutz als Blatt- und Bodenfungizide eingesetzt werden.



- Besondere Bedeutung haben sie für die Bekämpfung einer Vielzahl von Pilzen an verschiedenen Kulturpflanzen wie Weizen, Roggen, Gerste, Hafer, Reis, Mais, Gras, Bananen, Baumwolle, Soja, Kaffee, Zuckerrohr, Wein, Obst- und Zierpflanzen und Gemüsepflanzen wie Gurken, Bohnen, Tomaten, Kartoffeln und Kürbisgewächsen, sowie an den Samen dieser Pflanzen.

Speziell eignen sie sich zur Bekämpfung folgender Pflanzenkrankheiten:

- *Alternaria*-Arten an Gemüse und Obst,
- 10 • *Bipolaris*- und *Drechslera*-Arten an Getreide, Reis und Rasen,
- *Blumeria graminis* (echter Mehltau) an Getreide,
- *Botrytis cinerea* (Grauschimmel) an Erdbeeren, Gemüse, Zierpflanzen und Reben,
- *Erysiphe cichoracearum* und *Sphaerotheca fuliginea* an Kürbisgewächsen,
- *Fusarium*- und *Verticillium*-Arten an verschiedenen Pflanzen,
- 15 • *Mycosphaerella*-Arten an Getreide, Bananen und Erdnüssen,
- *Phytophthora infestans* an Kartoffeln und Tomaten,
- *Plasmopara viticola* an Reben,
- *Podosphaera leucotricha* an Äpfeln,
- *Pseudocercospora herpotrichoides* an Weizen und Gerste,
- 20 • *Pseudoperonospora*-Arten an Hopfen und Gurken,
- *Puccinia*-Arten an Getreide,
- *Pyricularia oryzae* an Reis,
- *Rhizoctonia*-Arten an Baumwolle, Reis und Rasen,
- *Septoria tritici* und *Stagonospora nodorum* an Weizen,
- 25 • *Ucinula necator* an Reben,
- *Ustilago*-Arten an Getreide und Zuckerrohr, sowie
- *Venturia*-Arten (Schorf) an Äpfeln und Birnen.

- Die Verbindungen I eignen sich außerdem zur Bekämpfung von Schadpilzen wie *Paecilomyces variotii* im Materialschutz (z.B. Holz, Papier, Dispersionen für den Anstrich, Fasern bzw. Gewebe) und im Vorratsschutz.

- Die Verbindungen I werden angewendet, indem man die Pilze oder die vor Pilzbefall zu schützenden Pflanzen, Saatgüter, Materialien oder den Erdboden mit einer fungizid wirksamen Menge der Wirkstoffe behandelt. Die Anwendung kann sowohl vor als auch nach der Infektion der Materialien, Pflanzen oder Samen durch die Pilze erfolgen.

Die fungiziden Mittel enthalten im allgemeinen zwischen 0,1 und 95, vorzugsweise zwischen 0,5 und 90 Gew.-% Wirkstoff.

- 5 Die Aufwandmengen liegen bei der Anwendung im Pflanzenschutz je nach Art des gewünschten Effektes zwischen 0,01 und 2,0 kg Wirkstoff pro ha.

Bei der Saatgutbehandlung werden im allgemeinen Wirkstoffmengen von 0,001 bis 0,1 g, vorzugsweise 0,01 bis 0,05 g je Kilogramm Saatgut benötigt.

10

Bei der Anwendung im Material- bzw. Vorratsschutz richtet sich die Aufwandmenge an Wirkstoff nach der Art des Einsatzgebietes und des gewünschten Effektes. Übliche Aufwandmengen sind im Materialschutz beispielsweise 0,001 g bis 2 kg, vorzugsweise 0,005 g bis 1 kg Wirkstoff pro Kubikmeter behandelten Materials.

15

Die Verbindungen I können in die üblichen Formulierungen überführt werden, z.B. Lösungen, Emulsionen, Suspensionen, Stäube, Pulver, Pasten und Granulate. Die Anwendungsform richtet sich nach dem jeweiligen Verwendungszweck; sie soll in jedem Fall eine feine und gleichmäßige Verteilung der erfindungsgemäßen Verbindung gewährleisten.

20

Die Formulierungen werden in bekannter Weise hergestellt, z.B. durch Verstrecken des Wirkstoffs mit Lösungsmitteln und/oder Trägerstoffen, gewünschtenfalls unter Verwendung von Emulgiermitteln und Dispergiernmitteln. Als Lösungsmittel / Hilfsstoffe kommen dafür im wesentlichen in Betracht:

25

- 30
- Wasser, aromatische Lösungsmittel (z.B. Solvesso Produkte, Xylol), Paraffine (z.B. Erdölfraktionen), Alkohole (z.B. Methanol, Butanol, Pentanol, Benzylalkohol), Ketone (z.B. Cyclohexanon, gamma-Butyrolacton), Pyrrolidone (NMP, NOP), Acetate (Glykoldiacetat), Glykole, Dimethylfettsäureamide, Fettsäuren und Fettsäureester. Grundsätzlich können auch Lösungsmittelgemische verwendet werden,
  - Trägerstoffe wie natürliche Gesteinsmehle (z.B. Kaoline, Tonerden, Talkum, Kreide) und synthetische Gesteinsmehle (z.B. hochdisperse Kieselsäure, Silikate); Emulgiermittel wie nichtionogene und anionische Emulgatoren (z.B. Polyoxyethylen-Fettalkohol-Ether, Alkylsulfonate und Arylsulfonate) und Dispergiermittel wie Lignin-Sulfitablaugen und Methylcellulose.
- 35

Als oberflächenaktive Stoffe kommen Alkali-, Erdalkali-, Ammoniumsalze von Ligninsulfonsäure, Naphthalinsulfonsäure, Phenolsulfonsäure, Dibutyl-naphthalinsulfonsäure, Alkylarylsulfonate, Alkylsulfate, Alkylsulfonate, Fettalkoholsulfate, Fettsäuren und sulfatierte Fettalkoholglykoether zum Einsatz, ferner Kondensationsprodukte von sulfoniertem Naphthalin und Naphthalinderivaten mit Formaldehyd, Kondensationsprodukte des Naphthalins bzw. der Naphthalinsulfonsäure mit Phenol und Formaldehyd, Polyoxyethylenoctylphenoether, ethoxyliertes Isooctylphenol, Octylphenol, Nonylphenol, Alkylphenolpolyglykoether, Tributylphenylpolyglykoether, Tristerylphenylpolyglykoether, Alkylarylpolyetheralkohole, Alkohol- und Fettalkoholethylenoxid-Kondensate, ethoxyliertes Rizinusöl, Polyoxyethylenalkylether, ethoxyliertes Polyoxypropylen, Laurylalkoholpolyglykoetheracetal, Sorbitester, Ligninsulfitablaugen und Methylcellulose in Betracht.

Zur Herstellung von direkt versprühbaren Lösungen, Emulsionen, Pasten oder Öldispersionen kommen Mineralölfractionen von mittlerem bis hohem Siedepunkt, wie Kerosin oder Dieselöl, ferner Kohlenteeröle sowie Öle pflanzlichen oder tierischen Ursprungs, aliphatische, cyclische und aromatische Kohlenwasserstoffe, z.B. Toluol, Xylol, Paraffin, Tetrahydronaphthalin, alkylierte Naphthaline oder deren Derivate, Methanol, Ethanol, Propanol, Butanol, Cyclohexanol, Cyclohexanon, Isophoron, stark polare Lösungsmittel, z.B. Dimethylsulfoxid, N-Methylpyrrolidon oder Wasser in Betracht.

20

Pulver-, Streu- und Stäubemittel können durch Mischen oder gemeinsames Vermahlen der wirksamen Substanzen mit einem festen Trägerstoff hergestellt werden.

Granulate, z.B. Umhüllungs-, Imprägnierungs- und Homogengranulate, können durch Bindung der Wirkstoffe an feste Trägerstoffe hergestellt werden. Feste Trägerstoffe sind z.B. Mineralerden, wie Kieselgele, Silikate, Talkum, Kaolin, Attaclay, Kalkstein, Kalk, Kreide, Bolus, Löß, Ton, Dolomit, Diatomeenerde, Calcium- und Magnesiumsulfat, Magnesiumoxid, gemahlene Kunststoffe, Düngemittel, wie z.B. Ammoniumsulfat, Ammoniumphosphat, Ammoniumnitrat, Harnstoffe und pflanzliche Produkte, wie Getreidemehl, Baumrinden-, Holz- und Nußschalenmehl, Cellulosepulver und andere feste Trägerstoffe.

Die Formulierungen enthalten im allgemeinen zwischen 0,01 und 95 Gew.-%, vorzugsweise zwischen 0,1 und 90 Gew.-% des Wirkstoffs. Die Wirkstoffe werden dabei in einer Reinheit von 90% bis 100%, vorzugsweise 95% bis 100% (nach NMR-Spektrum) eingesetzt.

35

Beispiele für Formulierungen sind: 1. Produkte zur Verdünnung in Wasser

A) Wasserlösliche Konzentrate (SL)

- 5 10 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in Wasser oder einem wasserlöslichen Lösungsmittel gelöst. Alternativ werden Netzmittel oder andere Hilfsmittel zugefügt. Bei der Verdünnung in Wasser löst sich der Wirkstoff.

B) Dispergierbare Konzentrate (DC)

10

20 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in Cyclohexanon unter Zusatz eines Dispergiermittels z.B. Polyvinylpyrrolidon gelöst. Bei Verdünnung in Wasser ergibt sich eine Dispersion.

15

C) Emulgierbare Konzentrate (EC)

15 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in Xylol unter Zusatz von Ca-Dodecylbenzolsulfonat und Ricinusölethoxylat (jeweils 5 %) gelöst. Bei der Verdünnung in Wasser ergibt sich eine Emulsion.

20

D) Emulsionen (EW, EO)

25

40 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in Xylol unter Zusatz von Ca-Dodecylbenzolsulfonat und Ricinusölethoxylat (jeweils 5 %) gelöst. Diese Mischung wird mittels einer Emulgiermaschine (Ultraturax) in Wasser eingebracht und zu einer homogenen Emulsion gebracht. Bei der Verdünnung in Wasser ergibt sich eine Emulsion.

30

E) Suspensionen (SC, OD)

20 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden unter Zusatz von Dispergier- und Netzmitteln und Wasser oder einem organischen Lösungsmittel in einer Rührwerkskugelmühle zu einer feinen Wirkstoffsuspension zerkleinert. Bei der Verdünnung in Wasser ergibt sich eine stabile Suspension des Wirkstoffs.

35

F) Wasserdispergierbare und wasserlösliche Granulate (WG, SG)

40

50 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden unter Zusatz von Dispergier- und Netzmitteln fein gemahlen und mittels technischer Geräte (z.B. Extrusion, Sprühturm, Wirbelschicht) als wasserdispergierbare oder wasserlösliche Granulate

hergestellt. Bei der Verdünnung in Wasser ergibt sich eine stabile Dispersion oder Lösung des Wirkstoffs.

G) Wasserdispersierbare und wasserlösliche Pulver (WP, SP)

5

75 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden unter Zusatz von Dispersier- und Netzmitteln sowie Kieselsäuregel in einer Rotor-Strator Mühle vermahlen. Bei der Verdünnung in Wasser ergibt sich eine stabile Dispersion oder Lösung des Wirkstoffs.

10

2. Produkte für die Direktapplikation

H) Stäube (DP)

5 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden fein gemahlen und mit 95 % feinteiligem Kaolin innig vermischt. Man erhält dadurch ein Stäubemittel.

I) Granulate (GR, FG, GG, MG)

20

0.5 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden fein gemahlen und mit 95.5 % Trägerstoffe verbunden. Gängige Verfahren sind dabei die Extrusion, die Sprühtrocknung oder die Wirbelschicht. Man erhält dadurch ein Granulat für die Direktapplikation.

25

J) ULV- Lösungen (UL)

10 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in einem organischen Lösungsmittel z.B. Xylol gelöst. Dadurch erhält man ein Produkt für die Direktapplikation.

30

Die Wirkstoffe können als solche, in Form ihrer Formulierungen oder den daraus bereiteten Anwendungsformen, z.B. in Form von direkt versprühbaren Lösungen, Pulvern, Suspensionen oder Dispersionen, Emulsionen, Öldispersionen, Pasten, Stäubemitteln, Streumitteln, Granulaten durch Versprühen, Vernebeln, Verstäuben, Verstreuen oder Gießen angewendet werden. Die Anwendungsformen richten sich ganz nach den Verwendungszwecken; sie sollten in jedem Fall möglichst die feinste Verteilung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe gewährleisten.

35

Wässrige Anwendungsformen können aus Emulsionskonzentraten, Pasten oder netzbaren Pulvern (Spritzpulver, Öldispersionen) durch Zusatz von Wasser bereitet werden.

40

den. Zur Herstellung von Emulsionen, Pasten oder Öldispersionen können die Substanzen als solche oder in einem Öl oder Lösungsmittel gelöst, mittels Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel in Wasser homogenisiert werden. Es können aber auch aus wirksamer Substanz Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel und eventuell Lösungsmittel oder Öl bestehende Konzentrate hergestellt werden, die zur Verdünnung mit Wasser geeignet sind.

Die Wirkstoffkonzentrationen in den anwendungsfertigen Zubereitungen können in größeren Bereichen variiert werden. Im allgemeinen liegen sie zwischen 0,0001 und 10%, vorzugsweise zwischen 0,01 und 1%.

Die Wirkstoffe können auch mit gutem Erfolg im Ultra-Low-Volume-Verfahren (ULV) verwendet werden, wobei es möglich ist, Formulierungen mit mehr als 95 Gew.-% Wirkstoff oder sogar den Wirkstoff ohne Zusätze auszubringen.

Zu den Wirkstoffen können Öle verschiedenen Typs, Netzmittel, Adjuvants, Herbizide, Fungizide, andere Schädlingsbekämpfungsmittel, Bakterizide, gegebenenfalls auch erst unmittelbar vor der Anwendung (Tankmix), zugesetzt werden. Diese Mittel können zu den erfindungsgemäßen Mitteln im Gewichtsverhältnis 1:10 bis 10:1 zugemischt werden.

Die erfindungsgemäßen Mittel können in der Anwendungsform als Fungizide auch zusammen mit anderen Wirkstoffen vorliegen, der z.B. mit Herbiziden, Insektiziden, Wachstumsregulatoren, Fungiziden oder auch mit Düngemitteln. Beim Vermischen der Verbindungen I bzw. der sie enthaltenden Mittel in der Anwendungsform als Fungizide mit anderen Fungiziden erhält man in vielen Fällen eine Vergrößerung des fungiziden Wirkungsspektrums.

Die folgende Liste von Fungiziden, mit denen die erfindungsgemäßen Verbindungen gemeinsam angewendet werden können, soll die Kombinationsmöglichkeiten erläutern, nicht aber einschränken:

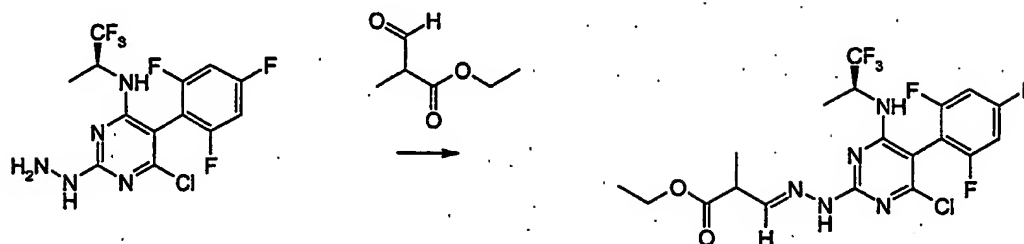
- Acylalanine wie Benalaxyl, Metalaxyl, Ofurace, Oxadixyl,
- Aminderivate wie Aldimorph, Dodine, Dodemorph, Fenpropimorph, Fenpropidin, Guazatine, Iminoctadine, Spiroxamin, Tridemorph
- Anilinopyrimidine wie Pyrimethanil, Mepanipyrim oder Cyrodinyl,
- Antibiotika wie Cycloheximid, Griseofulvin, Kasugamycin, Natamycin, Polyoxin oder Streptomycin,

- Azole wie Bitertanol, Bromoconazol, Cyproconazol, Difenconazole, Dinitroconazol, Epoxiconazol, Fenbuconazol, Fluquiconazol, Flusilazol, Hexaconazol, Imazalil, Metconazol, Myclobutanil, Penconazol, Propiconazol, Prochloraz, Prothioconazol, Tebuconazol, Triadimefon, Triadimenol, Triflumizol, Triticonazol,
- 5 • Dicarboximide wie Iprodion, Myclobutol, Procymidon, Vinclozolin,
- Dithiocarbamate wie Ferbam, Nabam, Maneb, Mancozeb, Metam, Metiram, Propinab, Polycarbamat, Thiram, Ziram, Zineb,
- Heterocyclische Verbindungen wie Anilazin, Benomyl, Boscalid, Carbendazim, Carboxin, Oxycarboxin, Cyazofamid, Dazomet, Dithianon, Famoxadon, Fenamidon,
- 10 • Fenarimol, Fuberidazol, Flutolanil, Furametpyr, Isoprothiolan, Mepronil, Nuarimol, Probenazol, Proquinazid, Pyrifenox, Pyroquilon, Quinoxifen, Silthiofam, Thiabendazol, Thifluzamid, Thiophanat-methyl, Tiadinil, Tricyclazol, Triforine,
- Kupferfungizide wie Bordeaux Brühe, Kupferacetat, Kupferoxychlorid, basisches Kupfersulfat,
- Nitrophenylderivate, wie Binapacryl, Dinocap, Dinobuton, Nitrophthal-isopropyl
- Phenylpyrrole wie Fenpiclonil oder Fludioxonil,
- Schwefel
- Sonstige Fungizide wie Acibenzolar-S-methyl, Benthiavalicarb, Carpropamid, Chlorothalonil, Cyflufenamid, Cymoxanil, Dazomet, Diclomezin, Diclocymet, Diethofencarb, Edifenphos, Ethaboxam, Fenhexamid, Fentin-Acetat, Fenoxanil, Ferimzone, Fluazinam, Fosetyl, Fosetyl-Aluminium, Iprovalicarb, Hexachlorbenzol, Metrafenon, Pencycuron, Propamocarb, Phthalid, Toloclofos-methyl, Quintozene, Zoxamid
- 20 • Strobilurine wie Azoxystrobin, Dimoxystrobin, Fluoxastrobin, Kresoxim-methyl, Metominostrobin, Orysastrobin, Picoxystrobin, Pyraclostrobin oder Trifloxystrobin,
- 25 • Sulfensäurederivate wie Captafol, Captan, Dichlofluamid, Folpet, Tolyfluanid
- Zimtsäureamide und Analoge wie Dimethomorph, Flumetover oder Flumorph.

## Synthesebeispiele

## Synthese der Hydrazid-Zwischenprodukte

## 5 Beispiel 1



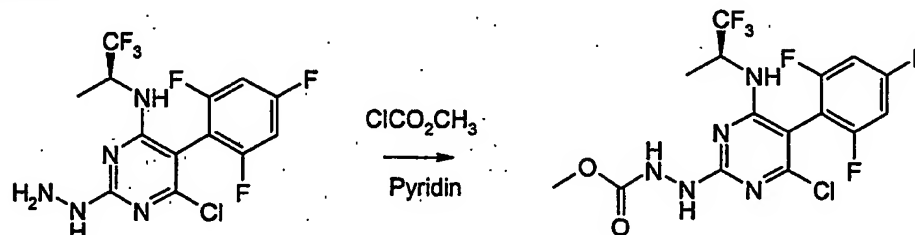
10

1.9 g (5 mmol) des Hydrazids wurden in 40 ml Diethylether vorgelegt. Dann gab man 0.8 g (5.5 mmol) des Aldehyds zu und rührte über Nacht bei Raumtemperatur nach. Reaktionskontrolle erfolgte über DC. Nach dem Entfernen des Lösungsmittels im Rotationsverdampfer wurde das Produkt säulenchromatographisch gereinigt (DCM). Man erhielt das Produkt als beigefarbene Kristalle. Ausbeute: 64%.

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ) = 1.2-1.3 (bm, 6 H); 1.4 (d, 3 H); 3.4 (m, 1 H); 4.2 (q, 2 H); 4.25 (d, 1 H, NH); 6.8 (m, 2 H); 7.3 (d, 1 H); 8.2 (bs, 1 H).

15

## Beispiel 2

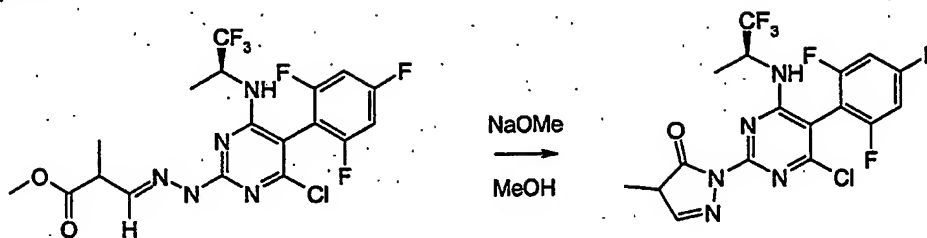


- 20 1.0 g (2.6 mmol) des Hydrazids wurden in 1 ml absolutem Pyridin gelöst. Dann gab man 0.25 g (2.6 mmol) Methylchlorformiat und 5 ml Wasser zu. Es wurde über Nacht nachgerührt. Reaktionskontrolle erfolgte über HPLC. Zur Aufarbeitung wurde der Feststoff abgesaugt und nacheinander mit 1.5 ml dest. Wasser, zweimal mit 10%iger Essigsäure und abschließend dreimal mit Wasser gewaschen. Nach dem Trocknen er-
- 25 hielt man 0.9 g des Produktes (75% Ausbeute).



## Wirkstoffbeispiele

## Beispiel 3



5

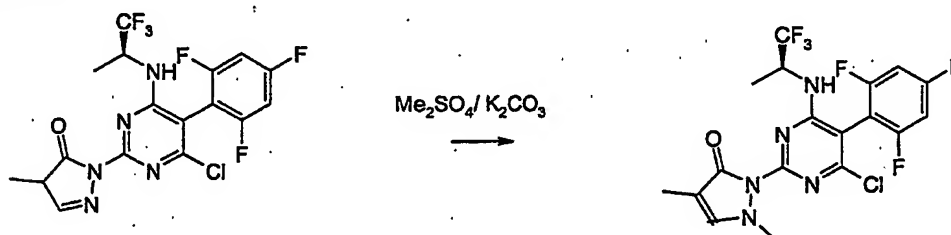
1.4 g (3 mmol) des Hydrazons (Beispiel 1) wurden in 10 ml abs. Methanol gelöst. Nach Zugabe von 0.6 g (3 mmol) Natriummethylat-Lösung (30% in Methanol) wurde über Nacht bei Raumtemperatur nachgerührt. Reaktionskontrolle erfolgte über HPLC. Nach dem Entfernen des Lösungsmittels im Rotationsverdampfer wurde das Reaktionsgemisch mit dest. Wasser verrührt und mit 5% Salzsäure auf pH 1-2 eingestellt. Es wurde dreimal mit DCM extrahiert und einmal mit gesättigter Natriumchlorid-Lösung nachgewaschen. Die vereinigten Extrakte wurden getrocknet und eingeeengt. Der Rückstand wurde mit Diisopropylether digeriert, abgesaugt, mit Diisopropylether und n-Pentan gewaschen und getrocknet. Das Produkt fiel als farbloser Feststoff an. Ausbeute: 0.7 g

15

(55%).

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ) ppm = 1.1 (d, 3 H); 1.4 (d, 3 H); 2.0 (s, 3 H); 4.9 (d, 1 H); 5.2 (m, 1 H); 6.9 (m, 2 H); 7.4 (d, 1 H).

## Beispiel 4



20

0.25 g des Pyrimidins (Beispiel 3) wurden in 5 ml Methanol gelöst und 0.15 g (1.2 mmol) Dimethylsulfat und 0.14 g (1 mmol) Kaliumcarbonat zugegeben. Man rührte drei Stunden bei RT nach. Reaktionskontrolle erfolgte über HPLC. Es wurde nochmals Dimethylsulfat (0.15 g, 1.2 mmol) zugegeben, so dass der Umsatz vollständig war. Zum Zerstören überschüssigen Dimethylsulfats wurde mit 10%iger wässriger Ammoniaklösung und Dichlormethan (DCM) gerührt. Nach der Phasentrennung wurde die wässrige Phase mit DCM extrahiert. Die vereinigten organischen Phasen wurden mit Wasser gewaschen und dann getrocknet. Nach dem Entfernen des Lösungsmittels im Rotati-

25

onsverdampfer wurde das Produkt säulenchromatographisch gereinigt (Toluol: Essig-  
ester 9:1; 7:3). Ausbeute: 100 mg (38%).

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ) ppm = 1.25 (d, 3 H); 1.8 (s, 3 H); 3.2 (s, 3 H); 5.0 (m, 1 H); 5.1 (m, 1 H); 6.8 (m, 2 H); 7.0 (m, 1 H).

5

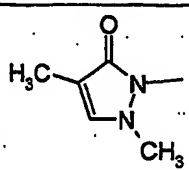
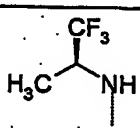
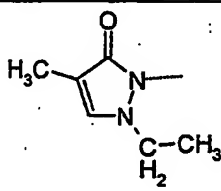
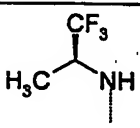
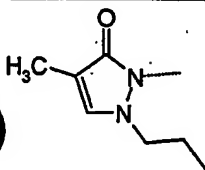
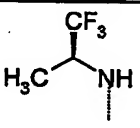
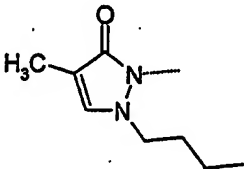
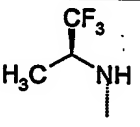
Die in den nachstehenden Synthesebeispielen wiedergegebenen Vorschriften wurden  
unter entsprechender Abwandlung der Ausgangsverbindungen zur Gewinnung weiterer  
Verbindungen I benutzt. Die so erhaltenen Verbindungen sind in der anschließenden  
Tabelle A mit physikalischen Angaben aufgeführt.

10

Tabelle A



| $\text{R}^4$ | $\text{NR}^1\text{R}^2$ | Phys. Konstanten |
|--------------|-------------------------|------------------|
|              |                         | Öl               |
|              |                         | Öl               |
|              |                         | Öl               |
|              |                         | Öl               |
|              |                         | Öl               |

| R <sup>4</sup>   | NR <sup>1</sup> R <sup>2</sup>  | Phys. Konstanten |
|--|---|------------------|
|   |  | Öl               |
|   |  | Öl               |
|   |  | Öl               |
|  |  | Öl               |

### Beispiele für die Wirkung gegen Schadpilze

Die fungizide Wirkung der Verbindungen der Formel I ließ sich durch die folgenden Versuche zeigen:

Die Wirkstoffe wurden getrennt oder gemeinsam als eine Stammlösung aufbereitet mit 0,25 Gew.-% Wirkstoff in Aceton oder DMSO. Dieser Lösung wurde 1 Gew.-% Emulgator Uniperol® EL (Netzmittel mit Emulgier- und Dispergierwirkung auf der Basis ethoxylierter Alkylphenole) zugesetzt und entsprechend der gewünschten Konzentration mit Wasser verdünnt.

### Anwendungsbeispiele

1. Wirksamkeit gegen die Dürffleckenkrankheit der Tomate verursacht durch *Alternaria solani* bei protektiver Anwendung

Blätter von Topfpflanzen der Sorte "Große Fleischtomate St. Pierre" wurden mit einer wässrigen Suspension in der unten angegebenen Wirkstoffkonzentration bis zur Tropfnässe besprüht. Am folgenden Tag wurden die Blätter mit einer wässrigen Sporenaufschwemmung von *Alternaria solani* in 2 % Biomalzlösung mit einer Dichte von

5  $0.17 \times 10^6$  Sporen/ml infiziert. Anschließend wurden die Pflanzen in einer wasserdampfgesättigten Kammer bei Temperaturen zwischen 20 und 22°C aufgestellt. Nach 5 Tagen hatte sich die Krautfäule auf den unbehandelten, jedoch infizierten Kontrollpflanzen so stark entwickelt, dass der Befall visuell in % ermittelt werden konnte.

10 Die mit den erfindungsgemäßen Wirkstoffen behandelten Pflanzen zeigten einen deutlich geringeren Befall als die unbehandelten Pflanzen.

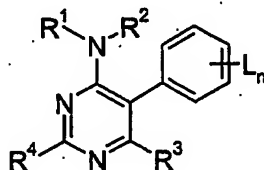
## 2-substituierte Pyrimidine, Verfahren zu deren Herstellung sowie deren Verwendung

## Zusammenfassung

5

Die vorliegende Erfindung betrifft Pyrimidine der Formel I,

## 1. 2-Substituierte Pyrimidine der Formel I

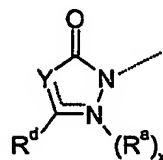
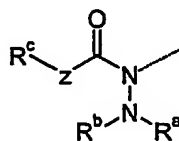


I

10

in der der Index n und die Substituenten L,  $R^1 - R^3$  die in der Beschreibung gegebene Bedeutung haben und $R^4$  einer der Formeln

15



entspricht,

20

sowie Verfahren und Zwischenprodukte zur Herstellung dieser Verbindungen, sie enthaltende Mittel sowie deren Verwendung zur Bekämpfung pflanzenpathogener Schadpilze.

**This Page is Inserted by IFW Indexing and Scanning  
Operations and is not part of the Official Record**

**BEST AVAILABLE IMAGES**

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images include but are not limited to the items checked:

- ☐ BLACK BORDERS
- ☐ IMAGE CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES
- ☐ FADED TEXT OR DRAWING
- ☐ BLURRED OR ILLEGIBLE TEXT OR DRAWING
- ☐ SKEWED/SLANTED IMAGES
- ☐ COLOR OR BLACK AND WHITE PHOTOGRAPHS
- ☐ GRAY SCALE DOCUMENTS
- ☒ LINES OR MARKS ON ORIGINAL DOCUMENT
- ☐ REFERENCE(S) OR EXHIBIT(S) SUBMITTED ARE POOR QUALITY
- ☐ OTHER: \_\_\_\_\_

**IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.**

**As rescanning these documents will not correct the image problems checked, please do not report these problems to the IFW Image Problem Mailbox.**